

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/001171

International filing date: 21 January 2005 (21.01.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP
Number: 2004-015360
Filing date: 23 January 2004 (23.01.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 10 March 2005 (10.03.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Genève, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

日 本 国 特 許 庁
JAPAN PATENT OFFICE

21.01.2005

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日 2 0 0 4 年 1 月 2 3 日
Date of Application:

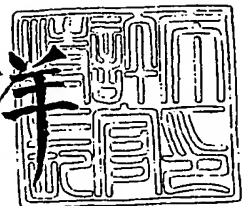
出 願 番 号 特 願 2 0 0 4 - 0 1 5 3 6 0
Application Number:
[ST. 10/C]: [J P 2 0 0 4 - 0 1 5 3 6 0]

出 願 人 三 共 ア グ ロ 株 式 会 社
Applicant(s):

2 0 0 5 年 2 月 2 5 日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

小 川 洋



出証番号 出証特 2 0 0 5 - 3 0 1 5 0 7 0

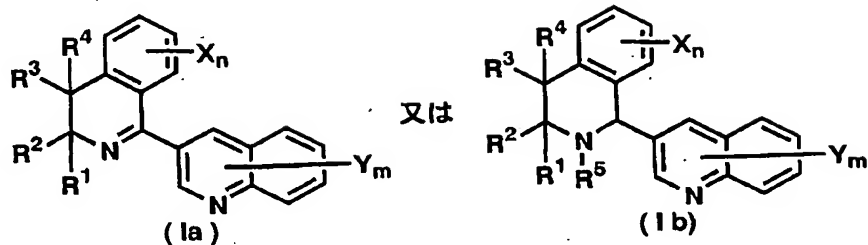
【書類名】 特許願
【整理番号】 KP-10891
【提出日】 平成16年 1月23日
【あて先】 特許庁長官殿
【発明者】
 【住所又は居所】 滋賀県野州郡野州町野州 8 9 4 三共アグロ株式会社内
 【氏名】 伊藤 寛之
【発明者】
 【住所又は居所】 滋賀県野州郡野州町野州 8 9 4 三共アグロ株式会社内
 【氏名】 藤原 宏太
【発明者】
 【住所又は居所】 滋賀県野州郡野州町野州 8 9 4 三共アグロ株式会社内
 【氏名】 森本 宗嗣
【発明者】
 【住所又は居所】 滋賀県野州郡野州町野州 8 9 4 三共アグロ株式会社内
 【氏名】 田中 治一
【発明者】
 【住所又は居所】 滋賀県野州郡野州町野州 8 9 4 三共アグロ株式会社内
 【氏名】 玉川 靖
【特許出願人】
 【識別番号】 303020956
 【氏名又は名称】 三共アグロ株式会社
【代理人】
 【識別番号】 100078662
 【弁理士】
 【氏名又は名称】 津国 肇
 【電話番号】 03(3502)7212
【選任した代理人】
 【識別番号】 100075225
 【弁理士】
 【氏名又は名称】 篠田 文雄
【選任した代理人】
 【識別番号】 100113653
 【弁理士】
 【氏名又は名称】 東田 幸四郎
【手数料の表示】
 【予納台帳番号】 023836
 【納付金額】 21,000円
【提出物件の目録】
 【物件名】 特許請求の範囲 1
 【物件名】 明細書 1
 【物件名】 要約書 1
 【包括委任状番号】 0311614

【書類名】 特許請求の範囲

【請求項1】

一般式 (I a) 又は (I b) :

【化1】



(式中、

 R^1 及び R^2 は、同一、若しくは異なってもよく、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアラルキル基であるか、又は、 R^1 と R^2 が一緒になって、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル環を表し、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、同一、若しくは異なってもよく、

水素原子；又は、

ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基を示し、

Xは、ハロゲン原子；

ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基；ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、フェニル基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル基；ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基

ト基及びC₁～C₆アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基；

ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁～C₆アルキル基及びC₁～C₆アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；

C₁～C₆アルコキシ基；

同一若しくは異なった1～2個のC₁～C₆アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基；

アシル基；

シアノ基；又は、

C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、アラルキル基、アリール基及びヘテロアリール基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基を表し、

Yは、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基及び水酸基からなる群から選ばれる置換基を表し、

nは、0～4の整数を表し、

mは、0～6の整数を表す)

で表される化合物又はその塩。

【請求項2】

R¹及びR²が、ハロゲン原子、C₁～C₆アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよいC₁～C₆アルキル基、又は、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基及び水酸基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項3】

R¹及びR²が、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁～C₆アルキル基、又は、同一若しくは異なった1～6個のハロゲン原子で置換されてよいフェニル基である、請求項1又は2に記載の化合物又はその塩。

【請求項4】

R¹及びR²が、メチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロエチル基、フェニル基、フルオロフェニル基、クロロフェニル基である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項5】

R³、R⁴及びR⁵が、水素原子、又はC₁～C₆アルキル基である、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項6】

Xが、ハロゲン原子；C₁～C₆アルキル基；C₂～C₆アルキニル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁～C₆アルキル基及びC₁～C₆アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁～C₆アルキル基及びC₁～C₆アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；シアノ基；又は、C₁～C₆アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基であり、nが、0～2の整数である、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項7】

Xが、ハロゲン原子；C₁～C₆アルキル基；C₂～C₆アルキニル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁～C₆アルキル基及びC₁～C₆アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；シアノ基；又は、C₁～C₆アルキル基及びフェニル基か

らなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカニイミドイル基であり、nが、0～2の整数である、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項8】

Xが、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチニル基、フリル基、チエニル基、シアノ基、メトキシエタンイミドイル基、エトキシエタンイミドイル基、フェノキシエタンイミドイル基であり、nが、0又は1である、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項9】

Yが、フッ素原子、塩素原子又はメチル基であり、mが、0又は1である、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項10】

Yが、メチル基であり、mが、0又は1である、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項11】

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(5-クロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(5-ブロモ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(5-エチニル-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(5, 6-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(3-エチル-5-フルオロ-3-メチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(5-フルオロ-3-メチル-3-プロピル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-(3-メチル-3-トリフルオロメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-[3-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン、
3-(3-メチル-3-フェニル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、
3-[3-メチル-3-(4-フルオロフェニル)-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン、
3-[3-メチル-3-(4-クロロフェニル)-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン、もしくは
3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン又はその塩である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項12】

請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農薬。

【書類名】明細書

【発明の名称】3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物

【技術分野】

【0001】

本発明は、3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物又はその塩、及びそれを有効成分として含有する農業に関する。

【背景技術】

【0002】

国際公開第00/42019号パンフレット(特許文献1)および国際公開第02/06270号パンフレット(特許文献2)には、ジヒドロイソキノリン環の3位と4位の間でシクロヘキサン環を形成している6-アリアルフェナンスリジン化合物がPDE4阻害剤として、また、特開2003/171381号公報(特許文献3)には、ジヒドロイソキノリン環の7位と8位の間でジヒドロフラン環を形成している6-アリアルフロイソキノリン化合物がエントリー阻害剤として記載されているが、イソキノリン環が別の環と縮合していない3-ジヒドロイソキノリン-1-イルキノリン化合物は記載されておらず、また、農園芸用殺菌剤に関する記載もない。また、Indian Journal of Chemistry 1969, 7(10), 1010-1016(非特許文献1)、同文献1970, 8(6), 505-508(非特許文献2)、同文献1985, 24B(7), 737-746(非特許文献3)、および同文献1986, 25B(10), 1072-1078(非特許文献4)には、3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物の合成の記載があるが、イソキノリン環の3位が2つの置換基により置換されている3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物は記載されておらず、また、農園芸用殺菌剤に関する記載もない。このように、イソキノリン環の3位が2つの置換基により置換されている3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物が農園芸用殺菌剤として使用できることは従来知られていない。

【0003】

本発明者らは、3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物について鋭意研究を重ねた結果、イソキノリン環の3位が2置換であり、かつ、イソキノリン環に他の環が縮合していない3-(ジヒドロ(テトラヒドロ)イソキノリン-1-イル)キノリン化合物が、種々の植物病害に対し優れた殺菌活性を有し農薬の有効成分として有用であり、特に、植物のかび病のなかでも農園芸用作物に対してしばしば重篤な被害を与えるイネいもち病(Pyricularia oryzae)並びにトマト、キュウリ及びインゲン灰色かび病(Botrytis cinerea)に対して低薬量で防除が可能であることを見出し、本発明を完成した。

【特許文献1】国際公開第00/42019号パンフレット

【特許文献2】国際公開第02/06270号パンフレット

【特許文献3】特開2003/171381号

【非特許文献1】Indian Journal of Chemistry 1969, 7(10), 1010-1016

【非特許文献2】Indian Journal of Chemistry 1970, 8(6), 505-508

【非特許文献3】Indian Journal of Chemistry 1985, 24B(7), 737-746

【非特許文献4】Indian Journal of Chemistry 1986, 25B(10), 1072-1078

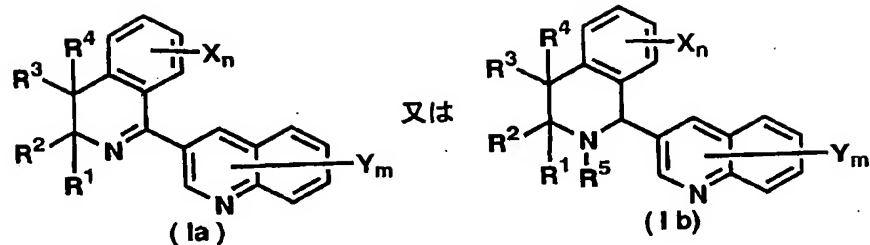
【発明の開示】

【0004】

本発明は、一般式(Ia)又は(Ib)：

【0005】

【化2】



【0006】

(式中、

R^1 及び R^2 は、同一、若しくは異なってもよく、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基；

ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1\sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基；

ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基及び $C_1\sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；

ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1\sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアラルキル基であるか、又は、

R^1 と R^2 が一緒になって、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル環を表し、

R^3 、 R^4 及び R^5 は、同一、若しくは異なってもよく、

水素原子；又は

ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基を示し、

Xは、ハロゲン原子；

ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基；

ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、フェニル基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_2\sim C_6$ アルケニル基；

ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_2\sim C_6$ アルキニル基；

ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1\sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基；

ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim$

C₆アルキル基及びC₁~C₆アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基;

C₁~C₆アルコキシ基;

同一若しくは異なった1~2個のC₁~C₆アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基;

アシル基;

シアノ基;又は、

C₁~C₆アルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、アラルキル基、アリール基及びヘテロアリール基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基を表し、

Yは、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基及び水酸基からなる群から選ばれる置換基を表し、

nは、0~4の整数を表し、

mは、0~6の整数を表す)

で表される化合物又はその塩である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0007】

本発明において、「C₁~C₆アルキル基」は、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2-メチルブチル基、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基、ヘキシル基、4-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、1-メチルペンチル基、3, 3-ジメチルブチル基、2, 2-ジメチルブチル基、1, 1-ジメチルペンチル基、3, 3-ジメチルブチル基、2, 2-ジメチルブチル基、2, 3-ジメチルブチル基、1, 2-ジメチルブチル基、1, 3-ジメチルブチル基、2, 3-ジメチルブチル基、2-エチルブチル基のような炭素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖アルキル基であり、好適には、炭素数1乃至5個の直鎖又は分枝鎖アルキル基(C₁~C₅アルキル基)であり、より好適には、炭素数1乃至4個の直鎖又は分枝鎖アルキル基(C₁~C₄アルキル基)であり、更により好適には、炭素数1乃至3個の直鎖又は分枝鎖アルキル基(C₁~C₃アルキル基)であり、特に好適には、メチル基、エチル基又はプロピル基であり、最も好適には、メチル基又はエチル基である。

【0008】

本発明において、「C₂~C₆アルケニル基」は直鎖又は分枝鎖状のいずれであってもよく、1以上の任意の個数の二重結合を含むことができる。例えば、ビニル基、プロパー1-エン-1-イル基、アリル基、イソプロペニル基、ブター1-エン-1-イル基、ブター2-エン-1-イル基、ブター3-エン-1-イル基、2-メチルプロパー2-エン-1-イル基、1-メチルプロパー2-エン-1-イル基、ペンター1-エン-1-イル基、ペンター2-エン-1-イル基、ペンター3-エン-1-イル基、ペンター4-エン-1-イル基、3-メチルブター2-エン-1-イル基、3-メチルブター3-エン-1-イル基、ヘキサー1-エン-1-イル基、ヘキサー2-エン-1-イル基、ヘキサー3-エン-1-イル基、ヘキサー4-エン-1-イル基、ヘキサー5-エン-1-イル基、4-メチルペンター3-エン-1-イル基などを例示することができる。

【0009】

本発明において、「C₂~C₆アルキニル基」は直鎖又は分枝鎖状のいずれであってもよく、1以上の任意の個数の三重結合を含むことができる。例えば、エチニル基、プロパー1-イン-1-イル基、プロパー2-イン-1-イル基、ブター1-イン-1-イル基、ブター3-イン-1-イル基、1-メチルプロパー2-イン-1-イル基、ペンター1-イン-1-イル基、ペンター4-イン-1-イル基、ヘキサー1-イン-1-イル基、ヘキサー5-イン-1-イル基などを例示することができる。

【0010】

本発明において、「アリール基」は、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントラセニル基、フェナントレニル基、アセナフチレニル基などを例示することができる。

る。

【0011】

本発明において、「ヘテロアリール基」は、単環性又は多環性のいずれであってもよく、1個又は2個以上の同一又は異なる環構成ヘテロ原子を含むヘテロアリール基を用いることができる。ヘテロ原子の種類は特に限定されないが、例えば、窒素原子、酸素原子、硫黄原子などを例示することができる。ヘテロアリール基としては、例えば、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、ジヒドロイソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ピリジル基、アゼビニル基、オキサゼビニル基などの5乃至7員の単環式ヘテロアリール基が挙げられる。ヘテロアリールアルキル基を構成する多環性ヘテロアリール基としては、ベンゾフラニル基、イソベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、インドリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、ベンゾオキサジアゾリル基、ベンゾチアジアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、シンノリニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、フタラジニル基、ナフチリジニル基、プリニル基、プテリジニル基、カルバゾリニル基、フタラジニル基、ナフチリジニル基、2-アクリジニル、3-アクリジニル、4-アクリジニル、カルボリニル基、アクリジニル基、2-アクリジニル、3-アクリジニル、4-アクリジニル、9-アクリジニル、フェノキサジニル基、フェノチアジニル基、フェナジニル基などの8乃至14員の多環性ヘテロアリール基が挙げられる。

【0012】

本発明において、「アラルキル基」としては、前記「C₁~C₆アルキル基」の1つ又は2つ以上の水素原子が前記「アリール基」で置換された基が挙げられる。例えば、ベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、アントラセニルメチル基、フェナントレニルメチル基、アセナフチレニルメチル基、ジフェニルメチル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、2-(1-ナフチル)エチル基、2-(2-ナフチル)エチル基、3-フェニルプロピル基、3-(1-ナフチル)プロピル基、3-(2-ナフチル)プロピル基、4-フェニルプロピル基、4-(1-ナフチル)プロピル基、4-(2-ナフチル)プロピル基、5-フェニルペンチル基、5-(1-ナフチル)ペンチル基、5-(2-ナフチル)ペンチル基、6-フェニルヘキシル基、6-(1-ナフチル)ヘキシル基、6-(2-ナフチル)ヘキシルなどを例示することができる。

【0013】

本発明において、「C₃~C₁₀シクロアルキル基」は、例えば、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、ノルボルニル基のような炭素数3~10個の単環又は複環シクロアルキル基であり、好適には、シクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、より好適には、シクロペンチル基である。

【0014】

本発明において、「ハロゲン原子」は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好適には、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子であり、より好適には、フッ素原子又は塩素原子であり、最も好適には、フッ素原子である。

【0015】

本発明において、「C₁~C₆アルコキシ基」は、例えば、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、2-メチルブトキシ基、ネオペンチルオキシ基、1-エチルプロポキシ基、ヘキシルオキシ基、(4-メチルペンチル)オキシ基、(3-メチルペンチル)オキシ基、(2-メチルペンチル)オキシ基、(1-メチルペンチル)オキシ基、3, 3-ジメチルブトキシ基、2, 2-ジメチルブトキシ基、1, 1-ジメチルブトキシ基、1, 2-ジメチルブトキシ基、1, 3-ジメチルブトキシ基、2, 3-ジメチルブトキシ基、2-エチルブトキシ基のような炭素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖アルコキシ基であり、好適には、炭素数1乃至4個の直鎖又は分枝鎖アルコ

キシ基 ($C_1 \sim C_4$ アルコキシ基) であり、より好適には、メトキシ基、エトキシ基又はイソプロポキシ基であり、更により好適には、メトキシ基又はエトキシ基であり、最も好適には、メトキシ基である。

【0016】

本発明において、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基」は、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソビルチオ基、ブチルチオ基、イソペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、3, 3-ジメチルブチルチオ基、2-エチルブチルチオ基のような炭素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖アルキルチオ基であり、好適には、炭素数1乃至4個の直鎖又は分枝鎖アルキルチオ基であり、より好適には、メチルチオ基である。

【0017】

本発明において、「アシル基」は、例えば、ホルミル基、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」が結合したカルボニル基 ($C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニル基)、前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」が結合したカルボニル基 ($C_3 \sim C_7$ アルケニルカルボニル基)、前記「アリール基」が結合したカルボニル基 («アリールカルボニル基»), 前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」が結合したカルボニル基 ($C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基) 又は前記「同一若しくは異なる1~2個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基で置換されてよいアミノ基」が結合したカルボニル基 ($C_2 \sim C_7$ アルキルアミノカルボニル基) であり、好適には、炭素数2~5個の直鎖又は分枝鎖アルキルカルボニル基 ($C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基)、炭素数2~7個のアルキルアミノカルボニル基 ($C_2 \sim C_7$ アルキルアミノカルボニル基) であり、より好適には、アセチル基又はメチルアミノカルボニル基である。

【0018】

本発明において、「同一若しくは異なる1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基」は、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」の他に、例えば、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブromoメチル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-ブromoエチル基、2-クロロエチル基、2-フルオロエチル基、3-クロロプロピル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、3-フルオロ-2-メチルプロピル基、3, 3, 3-トリフルオロ-2-メチルプロピル基、6, 6, 6-トリクロロヘキシル基のような同一若しくは異なる1~3個の前記「ハロゲン原子」により置換された前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、同一若しくは異なる1~3個の前記「ハロゲン原子」により置換されてよい前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」であり、より好適には、同一若しくは異なる1~3個の「フッ素原子又は塩素原子」により置換されてよい前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」であり、更により好適には、メチル基、エチル基、プロピル基、クロロメチル基又はトリフルオロメチル基であり、特に好適には、メチル基、エチル基又はトリフルオロメチル基である。

【0019】

本発明において、「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、アラルキル基、アリール基、及びヘテロアリール基からなる群から選ばれる置換基で、水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基」は、例えば、ヒドロキシイミノメチル基、N-ヒドロキシエタンイミドイル基、N-ヒドロキシプロパンイミドイル基、N-ヒドロキシブタンイミドイル基のような炭素数1~6個のN-ヒドロキシアルカンイミドイル基の水酸基が前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」、前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」、前記「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」、前記「アラルキル基」、前記「アリール基」、及び前記「ヘテロアリール基」により置換された基が挙げられる。例えば、メトキシイミノメチル基、N-メトキシエタンイミドイル基、N-エトキシエタンイミドイル基、N-ブトキシアルカンイミドイル基、N-アリルオキシエタンイミドイル基、N-フェノキシエタンイミドイル基、N-メトキシプロパンイミドイル基、N-メトキシブタンイミドイル基、N-メトキシヘキサンイミドイル基が挙げられる。

【0020】

本発明において、「ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基」は、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」及び前記「同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基」の他に、例えば、メトキシメチル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、プロポキシメチル基などの同一若しくは異なった1～3個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」により置換された前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」、フェノキシメチル基、フェノキシエチル基などのフェノキシ基により置換された前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」、及び2-メトキシ-1-クロロメチル基、3-フェノキシ-2-プロモ-2-メトキシプロピル基など、ハロゲン原子、前記 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる2種以上の置換基により置換された前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」も含む。

【0021】

本発明において、「ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、フェニル基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」は、前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」の他、3-クロロアリル基、4-プロモ-2-ブテニル基などの同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」、3-メトキシ-2-プロベニル基、4-エトキシ-3-ブテニル基などの同一若しくは異なった1～3個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」、1-フェニルビニル基、スチリル基、ジエンナミル基などのフェニル基により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」、3-フェノキシ-2-ブテニル基などのフェノキシ基により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」、及び4-メトキシ-3-クロロ-2-ブテニル基など、ハロゲン原子、前記 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる2種以上の置換基により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」も含む。

【0022】

本発明において、「ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～3個の置換基で置換されてよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」は、前記「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」の他、3-クロロ-2-プロピニル基、4-プロモ-2-ブチニル基などの同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」、3-メトキシ-2-プロピニル基、4-エトキシ-3-ブチニル基などの同一若しくは異なった1～3個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」、3-フェノキシ-2-ブチニル基などのフェノキシ基により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」、及び4-メトキシ-4-クロロ-2-ブチニル基など、ハロゲン原子、前記 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる2種以上の置換基により置換された前記「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」も含む。

【0023】

本発明において、「同一若しくは異なった1～2個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基」は、アミノ基の他に、同一若しくは異なった1～2個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」又は同一若しくは異なった1～2個の前記「アシル基」が置換したアミノ基であり、好適には、同一若しくは異なった1～2個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」又は同一若しくは異なった1～2個の前記「アシル基」が置換したアミノ基であり、より好適には、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、又はアセチルアミノ基である。

【0024】

本発明において、「ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、同一若しくは異なった1～2個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいアリール基」は、前記「アリール基」の他、同一若しくは異なった1～6個のハロゲン原子で置換された前記「アリール基」、同一若

しくは異なった1~6個の前記「同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基」で置換された前記「アリール基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「C₁~C₆アルコキシ基」により置換された前記「アリール基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「同一若しくは異なった1~2個のC₁~C₆アルキル基、又はアシル基で置換されてよいアミノ基」により置換された前記「アリール基」、1~6個のニトロ基で置換された前記「アリール基」、1~6個のシアノ基で置換された前記「アリール基」、1~6個の水酸基で置換された前記「アリール基」、1~6個のメルカプト基で置換された前記「アラルキル基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「C₁~C₆アルキルチオ基」により置換された前記「アリール基」の他、ハロゲン原子、前記「同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基」、前記「C₁~C₆アルコキシ基」、前記「同一若しくは異なった1~2個のC₁~C₆アルキル基又はアシル基で置換されてよいアミノ基」、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び前記「C₁~C₆アルキルチオ基」からなる群から選ばれる2種以上の置換基により置換された前記「アリール基」も含む。

【0025】

本発明において、「ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基及び水酸基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基」は、前記「ヘテロアリール基」の他、同一若しくは異なった1~6個のハロゲン原子で置換された前記「ヘテロアリール基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基」により置換された前記「ヘテロアリール基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「C₁~C₆アルコキシ基」により置換された前記「ヘテロアリール基」、1~6個の水酸基により置換された前記「ヘテロアリール基」の他、ハロゲン原子、前記「C₁~C₆アルキル基」、前記「C₁~C₆アルコキシ基」及び水酸基からなる群から選ばれる2種以上の置換基により置換された前記「ヘテロアリール基」も含む。

【0026】

本発明において、「ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、同一若しくは異なった1~2個のC₁~C₆アルキル基、又はアシル基で置換されてよいアミノ基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及びC₁~C₆アルキルチオ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいアラルキル基」は、前記「アラルキル基」の他、同一若しくは異なった1~6個のハロゲン原子で置換された前記「アラルキル基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基」で置換された前記「アラルキル基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「C₁~C₆アルコキシ基」により置換された前記「アラルキル基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「同一若しくは異なった1~2個のC₁~C₆アルキル基、又はアシル基で置換されてよいアミノ基」により置換された前記「アラルキル基」、1~6個のシアノ基で置換された前記「アラルキル基」、1~6個のニトロ基で置換された前記「アラルキル基」、1~6個の水酸基で置換された前記「アラルキル基」、1~6個のメルカプト基で置換された前記「アラルキル基」、同一若しくは異なった1~6個の前記「C₁~C₆アルキルチオ基」により置換された前記「アラルキル基」の他、ハロゲン原子、前記「同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよいC₁~C₆アルキル基」、前記「C₁~C₆アルコキシ基」、前記「、又はアシ、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基及び前記「C₁~C₆アルキルチオ基」からなる群から選ばれる2種以上の置換基により置換された前記「アラルキル基」も含む。アラルキル基が置換基を有する場合、当該置換基はアラルキル基を構成するアリール環上又はアルキル基上のいずれか又は両方に置換していてもよい。

【0027】

Xはイソキノリン環上の置換可能な任意の位置に1個ないし4個置換することができ、

Xが2個以上存在する場合には、それらは同一でも異なってもよい。

【0028】

Yはキノリン環上の置換可能な任意の位置に1個ないし6個置換することができ、Yが2個以上存在する場合には、それらは同一でも異なってもよい。

【0029】

本発明の化合物 (Ia)、又は、(Ib) において、

(1) R^1 及び R^2 は、好適には、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~3個の置換基で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基；又は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及び水酸基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいアリール基であり、より好適には、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基、又は、同一若しくは異なった1~6個のハロゲン原子で置換されてよいフェニル基であり、更により好適には、メチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロエチル基、フェニル基、フルオロフェニル基、クロロフェニル基であり、

(2) R^3 、 R^4 及び R^5 は、好適には、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基であり、

(3) X_n は、好適には、Xが、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_2 \sim C_6$ アルキニル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいアリール基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；シアノ基；又は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基であり、nが、0~2の整数であり、より好適には、Xが、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキニル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；シアノ基；又は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基であり、nが、0~2の整数であり、更により好適には、Xが、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチニル基、フリル基、チエニル基、シアノ基、メトキシエタンイミドイル基、エトキシエタンイミドイル基又はフェノキシエタンイミドイル基であり、nが、0又は1であり、

(4) Y_m は、好適には、Yが、フッ素原子、塩素原子又はメチル基であり、mが、0又は1であり、より好適には、Yが、メチル基であり、mが、0又は1である。

【0030】

本発明の化合物 (Ia)、又は、(Ib) において、好適には、

(a1) R^1 及び R^2 は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~3個の置換基で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基；又は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基及び水酸基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいアリール基であり、

(a2) R^3 、 R^4 及び R^5 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基であり、

(a3) X_n は、Xが、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいアリール基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1~3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1~6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；シアノ基；又は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子

が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基であり、 n が、0～2の整数であり、

(a4) Y_m は、 Y が、フッ素原子、塩素原子又はメチル基であり、 m が、0又は1であり、

より好適には、

(b1) R^1 及び R^2 は、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、又は、同一若しくは異なった1～6個のハロゲン原子で置換されてよいフェニル基であり、

(b2) R^3 及び R^4 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル基であり、 R^5 は、水素原子であり、

(b3) X_n は、 X が、ハロゲン原子； $C_1\sim C_6$ アルキル基； $C_2\sim C_6$ アルキニル基；ハロゲン原子、同一若しくは異なった1～3個のハロゲン原子で置換されてよい $C_1\sim C_6$ アルキル基及び $C_1\sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一若しくは異なった1～6個の置換基で置換されてよいヘテロアリール基；シアノ基；又は、 $C_1\sim C_6$ アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれる置換基で水酸基の水素原子が置換されてよいN-ヒドロキシアルカンイミドイル基であり、 n が、0～2の整数であり、

(b4) Y_m は、 Y が、フッ素原子、塩素原子又はメチル基であり、 m が、0又は1であり、

更により好適には、

(c1) R^1 及び R^2 は、メチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロエチル基、フェニル基、フルオロフェニル基又はクロロフェニル基であり、

(c2) R^3 及び R^4 は、メチル基であり、 R^5 は、水素原子であり、

(c3) X_n は、 X が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチニル基、フリル基、チエニル基、シアノ基、メトキシエタンイミドイル基、エトキシエタンイミドイル基又はフェノキシエタンイミドイル基であり、 n が、0又は1であり、

(c4) Y_m は、 Y が、メチル基であり、 m が、0又は1であり、

最も好適には、

(d) 化合物 (Ia)、又は、(Ib) が、

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(5-クロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(5-ブロモ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(5-エチニル-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(5, 6-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(3-エチル-5-フルオロ-3-メチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(5-フルオロ-3-メチル-3-プロピル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-(3-メチル-3-トリフルオロメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-[3-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン、

3-(3-メチル-3-フェニル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、

3-[3-メチル-3-(4-フルオロフェニル)-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン、

3-[3-メチル-3-(4-クロロフェニル)-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン、

イル]キノリン、又は

3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリンである。

【0031】

本発明の化合物 (Ia)、又は、(Ib) は、例えば、硫酸塩、塩酸塩、硝酸塩、リン酸塩のような塩にすることができる。それらの塩は、農園芸用の殺菌剤として使用できる限り、本発明に包含される。

【0032】

本発明化合物 (Ia)、又は、(Ib) 及びそれらの塩は溶媒和物にすることができ、それら溶媒和物も、本発明に包含される。そのような溶媒和物は、好適には、水和物である。

【0033】

本発明化合物 (Ia)、又は、(Ib) 中には、不斉炭素を有する化合物もあり、その場合には、本願発明は、一種の光学活性体及び数種の光学活性体の任意の割合の混合物をも包含する。

【0034】

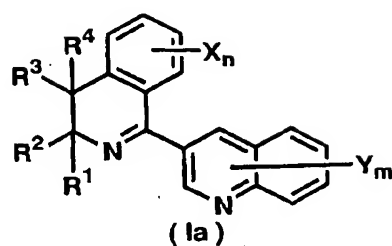
本発明の代表化合物を下記表に例示するが、本発明はこれらの化合物に限定されるものではない。

【0035】

以下、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「iPr」はイソプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「iBu」はイソブチル基を、「tBu」はtブチル基を、「iPen」はイソペンチル基を、「Vinyl」は、ビニル基を、「Allyl」は、アリル基を、「Ethynyl」はエチニル基を、「Ph」はフェニル基を、「FUR」はフリル基を、「2THI」は2-チエニル基を、「OXA」はオキサゾリル基を、「Ac」はアセチル基を、「EtIMD」はN-ヒドロキシエタンイミドイル基を、「3PYD」は3-ピリジル基を、「Bn」はベンジル基を、「cPen」はRとR'とで環を形成してシクロペンチル基を、「cHex」はR¹とR²とで環を形成してシクロヘキシル基を、「cHept」はR¹とR²とで環を形成してシクロヘプチル基を、「X_n」および「Y_m」において「H」はn=0およびm=0を、それぞれ示す。

【0036】

【表1】



化合物番号	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
1-1	Me, Me	H, H	H	H
1-2	Me, Me	H, H	H	2-F
1-3	Me, Me	H, H	H	4-F
1-4	Me, Me	H, H	H	5-F
1-5	Me, Me	H, H	H	6-F
1-6	Me, Me	H, H	H	7-F
1-7	Me, Me	H, H	H	8-F
1-8	Me, Me	H, H	H	2-Cl
1-9	Me, Me	H, H	H	4-Cl
1-10	Me, Me	H, H	H	5-Cl
1-11	Me, Me	H, H	H	6-Cl
1-12	Me, Me	H, H	H	7-Cl
1-13	Me, Me	H, H	H	8-Cl
1-14	Me, Me	H, H	H	2-Me
1-15	Me, Me	H, H	H	4-Me
1-16	Me, Me	H, H	H	5-Me
1-17	Me, Me	H, H	H	6-Me
1-18	Me, Me	H, H	H	7-Me
1-19	Me, Me	H, H	H	8-Me
1-20	Me, Me	H, H	H	2-MeO
1-21	Me, Me	H, H	H	4-MeO
1-22	Me, Me	H, H	H	5-MeO
1-23	Me, Me	H, H	H	6-MeO
1-24	Me, Me	H, H	H	7-MeO
1-25	Me, Me	H, H	H	8-MeO
1-26	Me, Me	H, H	H	2-OH
1-27	Me, Me	H, H	H	4-OH
1-28	Me, Me	H, H	H	5-OH
1-29	Me, Me	H, H	H	6-OH
1-30	Me, Me	H, H	H	7-OH
1-31	Me, Me	H, H	H	8-OH
1-32	Me, Me	H, H	5-F	H
1-33	Me, Me	H, H	5-F	4-F
1-34	Me, Me	H, H	5-F	8-F
1-35	Me, Me	H, H	5-F	4-Cl

1-36	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl
1-37	Me, Me	H, H	5-F	4-MeO
1-38	Me, Me	H, H	5-F	8-Me
1-39	Me, Me	H, H	5-F	8-MeO
1-40	Me, Me	H, H	5-F	8-OH
1-41	Me, Me	H, H	6-F	H
1-42	Me, Me	H, H	7-F	H
1-43	Me, Me	H, H	8-F	H
1-44	Me, Me	H, H	5-Cl	H
1-45	Me, Me	H, H	5-Cl	4-F
1-46	Me, Me	H, H	5-Cl	8-F
1-47	Me, Me	H, H	5-Cl	4-Cl
1-48	Me, Me	H, H	5-Cl	6-Cl
1-49	Me, Me	H, H	5-Cl	4-Me
1-50	Me, Me	H, H	5-Cl	8-Me
1-51	Me, Me	H, H	5-Cl	8-MeO
1-52	Me, Me	H, H	5-Cl	8-OH
1-53	Me, Me	H, H	6-Cl	H
1-54	Me, Me	H, H	7-Cl	H
1-55	Me, Me	H, H	8-Cl	H
1-56	Me, Me	H, H	5-Br	H
1-57	Me, Me	H, H	5-Br	4-F
1-58	Me, Me	H, H	5-Br	8-F
1-59	Me, Me	H, H	5-Br	4-Cl
1-60	Me, Me	H, H	5-Br	6-Cl
1-61	Me, Me	H, H	5-Br	4-Me
1-62	Me, Me	H, H	5-Br	8-Me
1-63	Me, Me	H, H	5-Br	8-MeO
1-64	Me, Me	H, H	5-Br	8-OH
1-65	Me, Me	H, H	6-Br	H
1-66	Me, Me	H, H	7-Br	H
1-67	Me, Me	H, H	8-Br	H
1-68	Me, Me	H, H	5-I	H
1-69	Me, Me	H, H	5-Me	H
1-70	Me, Me	H, H	6-Me	H
1-71	Me, Me	H, H	7-Me	H
1-72	Me, Me	H, H	8-Me	H
1-73	Me, Me	H, H	5-Et	H
1-74	Me, Me	H, H	6-Et	H
1-75	Me, Me	H, H	7-Et	H
1-76	Me, Me	H, H	8-Et	H
1-77	Me, Me	H, H	5-Pr	H
1-78	Me, Me	H, H	6-Pr	H

1-79	Me, Me	H, H	7-Pr	H
1-80	Me, Me	H, H	8-Pr	H
1-81	Me, Me	H, H	5-Vinyl	H
1-82	Me, Me	H, H	6-Vinyl	H
1-83	Me, Me	H, H	7-Vinyl	H
1-84	Me, Me	H, H	8-Vinyl	H
1-85	Me, Me	H, H	5-Etynyl	H
1-86	Me, Me	H, H	6-Etynyl	H
1-87	Me, Me	H, H	7-Etynyl	H
1-88	Me, Me	H, H	8-Etynyl	H
1-89	Me, Me	H, H	5-Ph	H
1-90	Me, Me	H, H	6-Ph	H
1-91	Me, Me	H, H	7-Ph	H
1-92	Me, Me	H, H	8-Ph	H
1-93	Me, Me	H, H	5-FUR	H
1-94	Me, Me	H, H	5-2THI	H
1-95	Me, Me	H, H	5-3THI	H
1-96	Me, Me	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-97	Me, Me	H, H	OXA	H
1-98	Me, Me	H, H	5-HEtIMD	H
1-99	Me, Me	H, H	5-MeMeIMD	H
1-100	Me, Me	H, H	5-MeEtIMD	H
1-101	Me, Me	H, H	5-EtEtIMD	H
1-102	Me, Me	H, H	5-PrEtIMD	H
1-103	Me, Me	H, H	5-tBulEtIMD	H
1-104	Me, Me	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-105	Me, Me	H, H	5-BnEtIMD	H
1-106	Me, Me	H, H	5-PhEtIMD	H
1-107	Me, Me	H, H	5-MeO	H
1-108	Me, Me	H, H	6-MeO	H
1-109	Me, Me	H, H	7-MeO	H
1-110	Me, Me	H, H	8-MeO	H
1-111	Me, Me	H, H	5-NH ₂	H
1-112	Me, Me	H, H	5-NHAc	H
1-113	Me, Me	H, H	5-CHO	H
1-114	Me, Me	H, H	5-Ac	H
1-115	Me, Me	H, H	5-CONHMe	H
1-116	Me, Me	H, H	5-CN	H
1-117	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	H
1-118	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	4-F
1-119	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	8-F
1-120	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	4-Cl
1-121	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	6-Cl

1-122	Me, Me	H, H	5,6-F2	4-Me
1-123	Me, Me	H, H	5,6-F2	8-Me
1-124	Me, Me	H, H	5,6-F2	8-MeO
1-125	Me, Me	H, H	5,6-F2	8-OH
1-126	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	H
1-127	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	4-F
1-128	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	8-F
1-129	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	4-Cl
1-130	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	6-Cl
1-131	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	4-Me
1-132	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	8-Me
1-133	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	8-MeO
1-134	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	8-OH
1-135	Me, Me	H, H	5-F,7-Me	H
1-136	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H
1-137	Me, Et	H, H	H	H
1-138	Me, Et	H, H	H	4-F
1-139	Me, Et	H, H	H	8-F
1-140	Me, Et	H, H	H	4-Cl
1-141	Me, Et	H, H	H	6-Cl
1-142	Me, Et	H, H	H	8-Cl
1-143	Me, Et	H, H	H	4-Me
1-144	Me, Et	H, H	H	8-Me
1-145	Me, Et	H, H	H	8-MeO
1-146	Me, Et	H, H	H	8-OH
1-147	Me, Et	H, H	5-F	H
1-148	Me, Et	H, H	6-F	H
1-149	Me, Et	H, H	7-F	H
1-150	Me, Et	H, H	5-Cl	H
1-151	Me, Et	H, H	6-Cl	H
1-152	Me, Et	H, H	7-Cl	H
1-153	Me, Et	H, H	5-Br	H
1-154	Me, Et	H, H	6-Br	H
1-155	Me, Et	H, H	7-Br	H
1-156	Me, Et	H, H	5-I	H
1-157	Me, Et	H, H	5-Me	H
1-158	Me, Et	H, H	5-Vinyl	H
1-159	Me, Et	H, H	5-Etynyl	H
1-160	Me, Et	H, H	5-Ph	H
1-161	Me, Et	H, H	5-FUR	H
1-162	Me, Et	H, H	5-2THI	H
1-163	Me, Et	H, H	5-3THI	H
1-164	Me, Et	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H

1-165	Me, Et	H, H	OXA	H
1-166	Me, Et	H, H	5-MeMeIMD	H
1-167	Me, Et	H, H	5-MeEtIMD	H
1-168	Me, Et	H, H	5-EtEtIMD	H
1-169	Me, Et	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-170	Me, Et	H, H	5-BnEtIMD	H
1-171	Me, Et	H, H	5-PhEtIMD	H
1-172	Me, Et	H, H	5-CN	H
1-173	Me, Et	H, H	5,6-F2	H
1-174	Me, Et	H, H	5,6-Cl2	H
1-175	Me, Pr	H, H	H	H
1-176	Me, Pr	H, H	H	4-F
1-177	Me, Pr	H, H	H	8-F
1-178	Me, Pr	H, H	H	4-Cl
1-179	Me, Pr	H, H	H	6-Cl
1-180	Me, Pr	H, H	H	8-Cl
1-181	Me, Pr	H, H	H	4-Me
1-182	Me, Pr	H, H	H	8-Me
1-183	Me, Pr	H, H	H	8-MeO
1-184	Me, Pr	H, H	H	8-OH
1-185	Me, Pr	H, H	5-F	H
1-186	Me, Pr	H, H	6-F	H
1-187	Me, Pr	H, H	7-F	H
1-188	Me, Pr	H, H	5-Cl	H
1-189	Me, Pr	H, H	6-Cl	H
1-190	Me, Pr	H, H	7-Cl	H
1-191	Me, Pr	H, H	5-Br	H
1-192	Me, Pr	H, H	6-Br	H
1-193	Me, Pr	H, H	7-Br	H
1-194	Me, Pr	H, H	5-I	H
1-195	Me, Pr	H, H	5-Me	H
1-196	Me, Pr	H, H	5-Vinyl	H
1-197	Me, Pr	H, H	5-Etynyl	H
1-198	Me, Pr	H, H	5-Ph	H
1-199	Me, Pr	H, H	5-FUR	H
1-200	Me, Pr	H, H	5-2THI	H
1-201	Me, Pr	H, H	5-3THI	H
1-202	Me, Pr	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-203	Me, Pr	H, H	OXA	H
1-204	Me, Pr	H, H	5-MeMeIMD	H
1-205	Me, Pr	H, H	5-MeEtIMD	H
1-206	Me, Pr	H, H	5-EtEtIMD	H
1-207	Me, Pr	H, H	5-AllylEtIMD	H

1-208	Me, Pr	H, H	5-BnEtIMD	H
1-209	Me, Pr	H, H	5-PhEtIMD	H
1-210	Me, Pr	H, H	5-CN	H
1-211	Me, Pr	H, H	5,6-F2	H
1-212	Me, Pr	H, H	5,6-Cl2	H
1-213	Me, iPr	H, H	H	H
1-214	Me, iPr	H, H	H	4-F
1-215	Me, iPr	H, H	H	8-F
1-216	Me, iPr	H, H	H	4-Cl
1-217	Me, iPr	H, H	H	6-Cl
1-218	Me, iPr	H, H	H	8-Cl
1-219	Me, iPr	H, H	H	4-Me
1-220	Me, iPr	H, H	H	8-Me
1-221	Me, iPr	H, H	H	8-MeO
1-222	Me, iPr	H, H	H	8-OH
1-223	Me, iPr	H, H	5-F	H
1-224	Me, iPr	H, H	6-F	H
1-225	Me, iPr	H, H	7-F	H
1-226	Me, iPr	H, H	5-Cl	H
1-227	Me, iPr	H, H	6-Cl	H
1-228	Me, iPr	H, H	7-Cl	H
1-229	Me, iPr	H, H	5-Br	H
1-230	Me, iPr	H, H	6-Br	H
1-231	Me, iPr	H, H	7-Br	H
1-232	Me, iPr	H, H	5-I	H
1-233	Me, iPr	H, H	5-Me	H
1-234	Me, iPr	H, H	5-Vinyl	H
1-235	Me, iPr	H, H	5-Etynyl	H
1-236	Me, iPr	H, H	5-Ph	H
1-237	Me, iPr	H, H	5-FUR	H
1-238	Me, iPr	H, H	5-2THI	H
1-239	Me, iPr	H, H	5-3THI	H
1-240	Me, iPr	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-241	Me, iPr	H, H	OXA	H
1-242	Me, iPr	H, H	5-MeMeIMD	H
1-243	Me, iPr	H, H	5-MeEtIMD	H
1-244	Me, iPr	H, H	5-EtEtIMD	H
1-245	Me, iPr	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-246	Me, iPr	H, H	5-BnEtIMD	H
1-247	Me, iPr	H, H	5-PhEtIMD	H
1-248	Me, iPr	H, H	5-CN	H
1-249	Me, iPr	H, H	5,6-F2	H
1-250	Me, iPr	H, H	5,6-Cl2	H

1-251	Me, iBu	H, H	H	H
1-252	Me, iBu	H, H	H	4-F
1-253	Me, iBu	H, H	H	8-F
1-254	Me, iBu	H, H	H	4-Cl
1-255	Me, iBu	H, H	H	6-Cl
1-256	Me, iBu	H, H	H	8-Cl
1-257	Me, iBu	H, H	H	4-Me
1-258	Me, iBu	H, H	H	8-Me
1-259	Me, iBu	H, H	H	8-MeO
1-260	Me, iBu	H, H	H	8-OH
1-261	Me, iBu	H, H	5-F	H
1-262	Me, iBu	H, H	6-F	H
1-263	Me, iBu	H, H	7-F	H
1-264	Me, iBu	H, H	5-Cl	H
1-265	Me, iBu	H, H	6-Cl	H
1-266	Me, iBu	H, H	7-Cl	H
1-267	Me, iBu	H, H	5-Br	H
1-268	Me, iBu	H, H	6-Br	H
1-269	Me, iBu	H, H	7-Br	H
1-270	Me, iBu	H, H	5-I	H
1-271	Me, iBu	H, H	5-Me	H
1-272	Me, iBu	H, H	5-Vinyl	H
1-273	Me, iBu	H, H	5-Etynyl	H
1-274	Me, iBu	H, H	5-Ph	H
1-275	Me, iBu	H, H	5-FUR	H
1-276	Me, iBu	H, H	5-2THI	H
1-277	Me, iBu	H, H	5-3THI	H
1-278	Me, iBu	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-279	Me, iBu	H, H	OXA	H
1-280	Me, iBu	H, H	5-MeMeIMD	H
1-281	Me, iBu	H, H	5-MeEtIMD	H
1-282	Me, iBu	H, H	5-EtEtIMD	H
1-283	Me, iBu	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-284	Me, iBu	H, H	5-BnEtIMD	H
1-285	Me, iBu	H, H	5-PhEtIMD	H
1-286	Me, iBu	H, H	5-CN	H
1-287	Me, iBu	H, H	5,6-F2	H
1-288	Me, iBu	H, H	5,6-Cl2	H
1-289	Me, tBu	H, H	H	H
1-290	Me, tBu	H, H	5-F	H
1-291	Me, tBu	H, H	5-Cl	H
1-292	Me, tBu	H, H	5-Br	H
1-293	Me, tBu	H, H	5-I	H

1-294	Me, tBu	H, H	5-Me	H
1-295	Me, tBu	H, H	5-Vinyl	H
1-296	Me, tBu	H, H	5-Etynyl	H
1-297	Me, tBu	H, H	5-Ph	H
1-298	Me, tBu	H, H	5-FUR	H
1-299	Me, tBu	H, H	5-2THI	H
1-300	Me, tBu	H, H	5-3THI	H
1-301	Me, tBu	H, H	5-MeEtIMD	H
1-302	Me, tBu	H, H	5-EtEtIMD	H
1-303	Me, tBu	H, H	5-PhEtIMD	H
1-304	Me, tBu	H, H	5-CN	H
1-305	Me, tBu	H, H	5,6-F2	H
1-306	Me, tBu	H, H	5,6-Cl2	H
1-307	Me, iPen	H, H	H	H
1-308	Me, iPen	H, H	H	4-F
1-309	Me, iPen	H, H	H	8-F
1-310	Me, iPen	H, H	H	4-Cl
1-311	Me, iPen	H, H	H	6-Cl
1-312	Me, iPen	H, H	H	8-Cl
1-313	Me, iPen	H, H	H	4-Me
1-314	Me, iPen	H, H	H	8-Me
1-315	Me, iPen	H, H	H	8-MeO
1-316	Me, iPen	H, H	H	8-OH
1-317	Me, iPen	H, H	5-F	H
1-318	Me, iPen	H, H	6-F	H
1-319	Me, iPen	H, H	7-F	H
1-320	Me, iPen	H, H	5-Cl	H
1-321	Me, iPen	H, H	6-Cl	H
1-322	Me, iPen	H, H	7-Cl	H
1-323	Me, iPen	H, H	5-Br	H
1-324	Me, iPen	H, H	6-Br	H
1-325	Me, iPen	H, H	7-Br	H
1-326	Me, iPen	H, H	5-I	H
1-327	Me, iPen	H, H	5-Me	H
1-328	Me, iPen	H, H	5-Vinyl	H
1-329	Me, iPen	H, H	5-Etynyl	H
1-330	Me, iPen	H, H	5-Ph	H
1-331	Me, iPen	H, H	5-FUR	H
1-332	Me, iPen	H, H	5-2THI	H
1-333	Me, iPen	H, H	5-3THI	H
1-334	Me, iPen	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-335	Me, iPen	H, H	OXA	H
1-336	Me, iPen	H, H	5-MeMeIMD	H

1-337	Me, iPen	H, H	5-MeEtIMD	H
1-338	Me, iPen	H, H	5-EtEtIMD	H
1-339	Me, iPen	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-340	Me, iPen	H, H	5-BnEtIMD	H
1-341	Me, iPen	H, H	5-PhEtIMD	H
1-342	Me, iPen	H, H	5-CN	H
1-343	Me, iPen	H, H	5,6-F2	H
1-344	Me, iPen	H, H	5,6-Cl2	H
1-345	Et, Et	H, H	H	H
1-346	Et, Et	H, H	H	4-F
1-347	Et, Et	H, H	H	8-F
1-348	Et, Et	H, H	H	4-Cl
1-349	Et, Et	H, H	H	6-Cl
1-350	Et, Et	H, H	H	8-Cl
1-351	Et, Et	H, H	H	4-Me
1-352	Et, Et	H, H	H	8-Me
1-353	Et, Et	H, H	H	8-MeO
1-354	Et, Et	H, H	H	8-OH
1-355	Et, Et	H, H	5-F	H
1-356	Et, Et	H, H	6-F	H
1-357	Et, Et	H, H	7-F	H
1-358	Et, Et	H, H	5-Cl	H
1-359	Et, Et	H, H	6-Cl	H
1-360	Et, Et	H, H	7-Cl	H
1-361	Et, Et	H, H	5-Br	H
1-362	Et, Et	H, H	6-Br	H
1-363	Et, Et	H, H	7-Br	H
1-364	Et, Et	H, H	5-I	H
1-365	Et, Et	H, H	5-Me	H
1-366	Et, Et	H, H	5-Vinyl	H
1-367	Et, Et	H, H	5-Etynyl	H
1-368	Et, Et	H, H	5-Ph	H
1-369	Et, Et	H, H	5-FUR	H
1-370	Et, Et	H, H	5-2THI	H
1-371	Et, Et	H, H	5-3THI	H
1-372	Et, Et	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-373	Et, Et	H, H	OXA	H
1-374	Et, Et	H, H	5-MeMeIMD	H
1-375	Et, Et	H, H	5-MeEtIMD	H
1-376	Et, Et	H, H	5-EtEtIMD	H
1-377	Et, Et	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-378	Et, Et	H, H	5-BnEtIMD	H
1-379	Et, Et	H, H	5-PhEtIMD	H

1-380	Et, Et	H, H	5-CN	H
1-381	Et, Et	H, H	5,6-F2	H
1-382	Et, Et	H, H	5,6-Cl2	H
1-383	Et, iBu	H, H	H	H
1-384	Pr, Pr	H, H	H	H
1-385	Me, ClCH2	H, H	H	H
1-386	Me, Cl2CH	H, H	H	H
1-387	Me, CF3	H, H	H	H
1-388	Me, CF3	H, H	H	4-F
1-389	Me, CF3	H, H	H	8-F
1-390	Me, CF3	H, H	H	4-Cl
1-391	Me, CF3	H, H	H	6-Cl
1-392	Me, CF3	H, H	H	8-Cl
1-393	Me, CF3	H, H	H	4-Me
1-394	Me, CF3	H, H	H	8-Me
1-395	Me, CF3	H, H	H	8-MeO
1-396	Me, CF3	H, H	H	8-OH
1-397	Me, CF3	H, H	5-F	H
1-398	Me, CF3	H, H	6-F	H
1-399	Me, CF3	H, H	7-F	H
1-400	Me, CF3	H, H	5-Cl	H
1-401	Me, CF3	H, H	6-Cl	H
1-402	Me, CF3	H, H	7-Cl	H
1-403	Me, CF3	H, H	5-Br	H
1-404	Me, CF3	H, H	6-Br	H
1-405	Me, CF3	H, H	7-Br	H
1-406	Me, CF3	H, H	5-I	H
1-407	Me, CF3	H, H	5-Me	H
1-408	Me, CF3	H, H	5-Vinyl	H
1-409	Me, CF3	H, H	5-Etynyl	H
1-410	Me, CF3	H, H	5-Ph	H
1-411	Me, CF3	H, H	5-FUR	H
1-412	Me, CF3	H, H	5-2THI	H
1-413	Me, CF3	H, H	5-3THI	H
1-414	Me, CF3	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-415	Me, CF3	H, H	OXA	H
1-416	Me, CF3	H, H	5-MeMeIMD	H
1-417	Me, CF3	H, H	5-MeEtIMD	H
1-418	Me, CF3	H, H	5-EtEtIMD	H
1-419	Me, CF3	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-420	Me, CF3	H, H	5-BnEtIMD	H
1-421	Me, CF3	H, H	5-PhEtIMD	H
1-422	Me, CF3	H, H	5-CN	H

1-423	Me, CF3	H, H	5,6-F2	H
1-424	Me, CF3CH2	H, H	5,6-Cl2	H
1-425	Me, CF3CH2	H, H	H	H
1-426	Me, CF3CH2	H, H	H	4-F
1-427	Me, CF3CH2	H, H	H	8-F
1-428	Me, CF3CH2	H, H	H	4-Cl
1-429	Me, CF3CH2	H, H	H	6-Cl
1-430	Me, CF3CH2	H, H	H	8-Cl
1-431	Me, CF3CH2	H, H	H	4-Me
1-432	Me, CF3CH2	H, H	H	8-Me
1-433	Me, CF3CH2	H, H	H	8-MeO
1-434	Me, CF3CH2	H, H	H	8-OH
1-435	Me, CF3CH2	H, H	5-F	H
1-436	Me, CF3CH2	H, H	6-F	H
1-437	Me, CF3CH2	H, H	7-F	H
1-438	Me, CF3CH2	H, H	5-Cl	H
1-439	Me, CF3CH2	H, H	6-Cl	H
1-440	Me, CF3CH2	H, H	7-Cl	H
1-441	Me, CF3CH2	H, H	5-Br	H
1-442	Me, CF3CH2	H, H	6-Br	H
1-443	Me, CF3CH2	H, H	7-Br	H
1-444	Me, CF3CH2	H, H	5-I	H
1-445	Me, CF3CH2	H, H	5-Me	H
1-446	Me, CF3CH2	H, H	5-Vinyl	H
1-447	Me, CF3CH2	H, H	5-Etynyl	H
1-448	Me, CF3CH2	H, H	5-Ph	H
1-449	Me, CF3CH2	H, H	5-FUR	H
1-450	Me, CF3CH2	H, H	5-2THI	H
1-451	Me, CF3CH2	H, H	5-3THI	H
1-452	Me, CF3CH2	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-453	Me, CF3CH2	H, H	OXA	H
1-454	Me, CF3CH2	H, H	5-MeMeIMD	H
1-455	Me, CF3CH2	H, H	5-MeEtIMD	H
1-456	Me, CF3CH2	H, H	5-EtEtIMD	H
1-457	Me, CF3CH2	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-458	Me, CF3CH2	H, H	5-BnEtIMD	H
1-459	Me, CF3CH2	H, H	5-PhEtIMD	H
1-460	Me, CF3CH2	H, H	5-CN	H
1-461	Me, CF3CH2	H, H	5,6-F2	H
1-462	Me, CF3CH2	H, H	5,6-Cl2	H
1-463	ClCH2, ClCH2	H, H	H	H
1-464	Me, Ph	H, H	H	H
1-465	Me, Ph	H, H	H	4-F

1-466	Me, Ph	H, H	H	8-F
1-467	Me, Ph	H, H	H	4-Cl
1-468	Me, Ph	H, H	H	6-Cl
1-469	Me, Ph	H, H	H	8-Cl
1-470	Me, Ph	H, H	H	4-Me
1-471	Me, Ph	H, H	H	8-Me
1-472	Me, Ph	H, H	H	8-MeO
1-473	Me, Ph	H, H	H	8-OH
1-474	Me, Ph	H, H	5-F	H
1-475	Me, Ph	H, H	6-F	H
1-476	Me, Ph	H, H	7-F	H
1-477	Me, Ph	H, H	5-Cl	H
1-478	Me, Ph	H, H	6-Cl	H
1-479	Me, Ph	H, H	7-Cl	H
1-480	Me, Ph	H, H	5-Br	H
1-481	Me, Ph	H, H	6-Br	H
1-482	Me, Ph	H, H	7-Br	H
1-483	Me, Ph	H, H	5-I	H
1-484	Me, Ph	H, H	5-Me	H
1-485	Me, Ph	H, H	5-Vinyl	H
1-486	Me, Ph	H, H	5-Etynyl	H
1-487	Me, Ph	H, H	5-Ph	H
1-488	Me, Ph	H, H	5-FUR	H
1-489	Me, Ph	H, H	5-2THI	H
1-490	Me, Ph	H, H	5-3THI	H
1-491	Me, Ph	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-492	Me, Ph	H, H	OXA	H
1-493	Me, Ph	H, H	5-MeMeIMD	H
1-494	Me, Ph	H, H	5-MeEtIMD	H
1-495	Me, Ph	H, H	5-EtEtIMD	H
1-496	Me, Ph	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-497	Me, Ph	H, H	5-BnEtIMD	H
1-498	Me, Ph	H, H	5-PhEtIMD	H
1-499	Me, Ph	H, H	5-CN	H
1-500	Me, Ph	H, H	5,6-F2	H
1-501	Me, Ph	H, H	5,6-Cl2	H
1-502	Me, FPh	H, H	H	H
1-503	Me, FPh	H, H	H	4-F
1-504	Me, FPh	H, H	H	8-F
1-505	Me, FPh	H, H	H	4-Cl
1-506	Me, FPh	H, H	H	6-Cl
1-507	Me, FPh	H, H	H	8-Cl
1-508	Me, FPh	H, H	H	4-Me

1-509	Me, FPh	H, H	H	8-Me
1-510	Me, FPh	H, H	H	8-MeO
1-511	Me, FPh	H, H	H	8-OH
1-512	Me, FPh	H, H	5-F	H
1-513	Me, FPh	H, H	6-F	H
1-514	Me, FPh	H, H	7-F	H
1-515	Me, FPh	H, H	5-Cl	H
1-516	Me, FPh	H, H	6-Cl	H
1-517	Me, FPh	H, H	7-Cl	H
1-518	Me, FPh	H, H	5-Br	H
1-519	Me, FPh	H, H	6-Br	H
1-520	Me, FPh	H, H	7-Br	H
1-521	Me, FPh	H, H	5-I	H
1-522	Me, FPh	H, H	5-Me	H
1-523	Me, FPh	H, H	5-Vinyl	H
1-524	Me, FPh	H, H	5-Etynyl	H
1-525	Me, FPh	H, H	5-Ph	H
1-526	Me, FPh	H, H	5-FUR	H
1-527	Me, FPh	H, H	5-2THI	H
1-528	Me, FPh	H, H	5-3THI	H
1-529	Me, FPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-530	Me, FPh	H, H	OXA	H
1-531	Me, FPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-532	Me, FPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-533	Me, FPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-534	Me, FPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-535	Me, FPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-536	Me, FPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-537	Me, FPh	H, H	5-CN	H
1-538	Me, FPh	H, H	5,6-F2	H
1-539	Me, FPh	H, H	5,6-Cl2	H
1-540	Me, ClPh	H, H	H	H
1-541	Me, ClPh	H, H	H	4-F
1-542	Me, ClPh	H, H	H	8-F
1-543	Me, ClPh	H, H	H	4-Cl
1-544	Me, ClPh	H, H	H	6-Cl
1-545	Me, ClPh	H, H	H	8-Cl
1-546	Me, ClPh	H, H	H	4-Me
1-547	Me, ClPh	H, H	H	8-Me
1-548	Me, ClPh	H, H	H	8-MeO
1-549	Me, ClPh	H, H	H	8-OH
1-550	Me, ClPh	H, H	5-F	H
1-551	Me, ClPh	H, H	6-F	H

1-552	Me, ClPh	H, H	7-F	H
1-553	Me, ClPh	H, H	5-Cl	H
1-554	Me, ClPh	H, H	6-Cl	H
1-555	Me, ClPh	H, H	7-Cl	H
1-556	Me, ClPh	H, H	5-Br	H
1-557	Me, ClPh	H, H	6-Br	H
1-558	Me, ClPh	H, H	7-Br	H
1-559	Me, ClPh	H, H	5-I	H
1-560	Me, ClPh	H, H	5-Me	H
1-561	Me, ClPh	H, H	5-Vinyl	H
1-562	Me, ClPh	H, H	5-Etynyl	H
1-563	Me, ClPh	H, H	5-Ph	H
1-564	Me, ClPh	H, H	5-FUR	H
1-565	Me, ClPh	H, H	5-2THI	H
1-566	Me, ClPh	H, H	5-3THI	H
1-567	Me, ClPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-568	Me, ClPh	H, H	OXA	H
1-569	Me, ClPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-570	Me, ClPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-571	Me, ClPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-572	Me, ClPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-573	Me, ClPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-574	Me, ClPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-575	Me, ClPh	H, H	5-CN	H
1-576	Me, ClPh	H, H	5,6-F2	H
1-577	Me, ClPh	H, H	5,6-Cl2	H
1-578	Ph, CF3	H, H	H	H
1-579	Ph, CF3	H, H	5-F	H
1-580	Ph, CF3	H, H	5-Cl	H
1-581	Ph, CF3	H, H	5-Br	H
1-582	Ph, CF3	H, H	5-I	H
1-583	Ph, CF3	H, H	5-Me	H
1-584	Ph, CF3	H, H	5-Vinyl	H
1-585	Ph, CF3	H, H	5-Etynyl	H
1-586	Ph, CF3	H, H	5-Ph	H
1-587	Ph, CF3	H, H	5-FUR	H
1-588	Ph, CF3	H, H	5-2THI	H
1-589	Ph, CF3	H, H	5-3THI	H
1-590	Ph, CF3	H, H	5-MeEtIMD	H
1-591	Ph, CF3	H, H	5-EtEtIMD	H
1-592	Ph, CF3	H, H	5-PhEtIMD	H
1-593	Ph, CF3	H, H	5-CN	H
1-594	ClCH2, FPh	H, H	H	H

1-595	CICH ₂ , FPh	H, H	H	4-F
1-596	CICH ₂ , FPh	H, H	H	8-F
1-597	CICH ₂ , FPh	H, H	H	4-Cl
1-598	CICH ₂ , FPh	H, H	H	6-Cl
1-599	CICH ₂ , FPh	H, H	H	8-Cl
1-600	CICH ₂ , FPh	H, H	H	4-Me
1-601	CICH ₂ , FPh	H, H	H	8-Me
1-602	CICH ₂ , FPh	H, H	H	8-MeO
1-603	CICH ₂ , FPh	H, H	H	8-OH
1-604	CICH ₂ , FPh	H, H	5-F	H
1-605	CICH ₂ , FPh	H, H	6-F	H
1-606	CICH ₂ , FPh	H, H	7-F	H
1-607	CICH ₂ , FPh	H, H	5-Cl	H
1-608	CICH ₂ , FPh	H, H	6-Cl	H
1-609	CICH ₂ , FPh	H, H	7-Cl	H
1-610	CICH ₂ , FPh	H, H	5-Br	H
1-611	CICH ₂ , FPh	H, H	6-Br	H
1-612	CICH ₂ , FPh	H, H	7-Br	H
1-613	CICH ₂ , FPh	H, H	5-I	H
1-614	CICH ₂ , FPh	H, H	5-Me	H
1-615	CICH ₂ , FPh	H, H	5-Vinyl	H
1-616	CICH ₂ , FPh	H, H	5-Etynyl	H
1-617	CICH ₂ , FPh	H, H	5-Ph	H
1-618	CICH ₂ , FPh	H, H	5-FUR	H
1-619	CICH ₂ , FPh	H, H	5-2THI	H
1-620	CICH ₂ , FPh	H, H	5-3THI	H
1-621	CICH ₂ , FPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-622	CICH ₂ , FPh	H, H	OXA	H
1-623	CICH ₂ , FPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-624	CICH ₂ , FPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-625	CICH ₂ , FPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-626	CICH ₂ , FPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-627	CICH ₂ , FPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-628	CICH ₂ , FPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-629	CICH ₂ , FPh	H, H	5-CN	H
1-630	CICH ₂ , FPh	H, H	5,6-F ₂	H
1-631	CICH ₂ , FPh	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-632	CICH ₂ , ClPh	H, H	H	H
1-633	CICH ₂ , ClPh	H, H	H	4-F
1-634	CICH ₂ , ClPh	H, H	H	8-F
1-635	CICH ₂ , ClPh	H, H	H	4-Cl
1-636	CICH ₂ , ClPh	H, H	H	6-Cl
1-637	CICH ₂ , ClPh	H, H	H	8-Cl

1-638	ClCH ₂ , ClPh	H, H	H	4-Me
1-639	ClCH ₂ , ClPh	H, H	H	8-Me
1-640	ClCH ₂ , ClPh	H, H	H	8-MeO
1-641	ClCH ₂ , ClPh	H, H	H	8-OH
1-642	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-F	H
1-643	ClCH ₂ , ClPh	H, H	6-F	H
1-644	ClCH ₂ , ClPh	H, H	7-F	H
1-645	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-Cl	H
1-646	ClCH ₂ , ClPh	H, H	6-Cl	H
1-647	ClCH ₂ , ClPh	H, H	7-Cl	H
1-648	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-Br	H
1-649	ClCH ₂ , ClPh	H, H	6-Br	H
1-650	ClCH ₂ , ClPh	H, H	7-Br	H
1-651	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-I	H
1-652	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-Me	H
1-653	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-Vinyl	H
1-654	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-Etynyl	H
1-655	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-Ph	H
1-656	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-FUR	H
1-657	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-2THI	H
1-658	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-3THI	H
1-659	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-660	ClCH ₂ , ClPh	H, H	OXA	H
1-661	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-662	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-663	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-664	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-665	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-666	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-667	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5-CN	H
1-668	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5,6-F ₂	H
1-669	ClCH ₂ , ClPh	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-670	Me, 3PYD	H, H	H	H
1-671	Me, 4PYD	H, H	H	H
1-672	Me, Bn	H, H	H	H
1-673	Me, Bn	H, H	H	4-F
1-674	Me, Bn	H, H	H	8-F
1-675	Me, Bn	H, H	H	4-Cl
1-676	Me, Bn	H, H	H	6-Cl
1-677	Me, Bn	H, H	H	8-Cl
1-678	Me, Bn	H, H	H	4-Me
1-679	Me, Bn	H, H	H	8-Me
1-680	Me, Bn	H, H	H	8-MeO

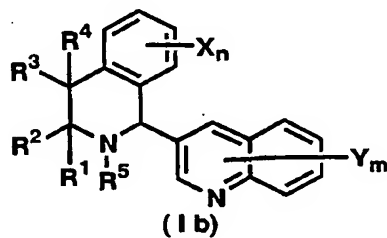
1-681	Me, Bn	H, H	H	8-OH
1-682	Me, Bn	H, H	5-F	H
1-683	Me, Bn	H, H	6-F	H
1-684	Me, Bn	H, H	7-F	H
1-685	Me, Bn	H, H	5-Cl	H
1-686	Me, Bn	H, H	6-Cl	H
1-687	Me, Bn	H, H	7-Cl	H
1-688	Me, Bn	H, H	5-Br	H
1-689	Me, Bn	H, H	6-Br	H
1-690	Me, Bn	H, H	7-Br	H
1-691	Me, Bn	H, H	5-I	H
1-692	Me, Bn	H, H	5-Me	H
1-693	Me, Bn	H, H	5-Vinyl	H
1-694	Me, Bn	H, H	5-Etynyl	H
1-695	Me, Bn	H, H	5-Ph	H
1-696	Me, Bn	H, H	5-FUR	H
1-697	Me, Bn	H, H	5-2THI	H
1-698	Me, Bn	H, H	5-3THI	H
1-699	Me, Bn	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-700	Me, Bn	H, H	OXA	H
1-701	Me, Bn	H, H	5-MeMeIMD	H
1-702	Me, Bn	H, H	5-MeEtIMD	H
1-703	Me, Bn	H, H	5-EtEtIMD	H
1-704	Me, Bn	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-705	Me, Bn	H, H	5-BnEtIMD	H
1-706	Me, Bn	H, H	5-PhEtIMD	H
1-707	Me, Bn	H, H	5-CN	H
1-708	Me, Bn	H, H	5,6-F2	H
1-709	Me, Bn	H, H	5,6-Cl2	H
1-710	cPen	H, H	H	H
1-711	cPen	H, H	H	4-F
1-712	cPen	H, H	H	8-F
1-713	cPen	H, H	H	4-Cl
1-714	cPen	H, H	H	6-Cl
1-715	cPen	H, H	H	8-Cl
1-716	cPen	H, H	H	4-Me
1-717	cPen	H, H	H	8-Me
1-718	cPen	H, H	H	8-MeO
1-719	cPen	H, H	H	8-OH
1-720	cPen	H, H	5-F	H
1-721	cPen	H, H	6-F	H
1-722	cPen	H, H	7-F	H
1-723	cPen	H, H	6-F	4-Me

1-724	cPen	H, H	5-Cl	H
1-725	cPen	H, H	6-Cl	H
1-726	cPen	H, H	7-Cl	H
1-727	cPen	H, H	5-Br	H
1-728	cPen	H, H	6-Br	H
1-729	cPen	H, H	7-Br	H
1-730	cPen	H, H	5-I	H
1-731	cPen	H, H	5-Me	H
1-732	cPen	H, H	5-Vinyl	H
1-733	cPen	H, H	5-Etynyl	H
1-734	cPen	H, H	5-Ph	H
1-735	cPen	H, H	5-FUR	H
1-736	cPen	H, H	5-2THI	H
1-737	cPen	H, H	5-3THI	H
1-738	cPen	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-739	cPen	H, H	OXA	H
1-740	cPen	H, H	5-MeMeIMD	H
1-741	cPen	H, H	5-MeEtIMD	H
1-742	cPen	H, H	5-EtEtIMD	H
1-743	cPen	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-744	cPen	H, H	5-BnEtIMD	H
1-745	cPen	H, H	5-PhEtIMD	H
1-746	cPen	H, H	5-CN	H
1-747	cPen	H, H	5,6-F2	H
1-748	cPen	H, H	5,6-Cl2	H
1-749	cHex	H, H	H	H
1-750	cHex	H, H	H	4-F
1-751	cHex	H, H	H	8-F
1-752	cHex	H, H	H	4-Cl
1-753	cHex	H, H	H	6-Cl
1-754	cHex	H, H	H	8-Cl
1-755	cHex	H, H	H	4-Me
1-756	cHex	H, H	H	8-Me
1-757	cHex	H, H	H	8-MeO
1-758	cHex	H, H	H	8-OH
1-759	cHex	H, H	5-F	H
1-760	cHex	H, H	6-F	H
1-761	cHex	H, H	7-F	H
1-762	cHex	H, H	5-F	4-Me
1-763	cHex	H, H	5-Cl	H
1-764	cHex	H, H	6-Cl	H
1-765	cHex	H, H	7-Cl	H
1-766	cHex	H, H	5-Cl	4-Me

1-767	cHex	H, H	5-Br	H	
1-768	cHex	H, H	6-Br	H	
1-769	cHex	H, H	7-Br	H	
1-770	cHex	H, H	5-I	H	
1-771	cHex	H, H	5-Me	H	
1-772	cHex	H, H	6-Me	H	
1-773	cHex	H, H	7-Me	H	
1-774	cHex	H, H	6-Me	4-Me	
1-775	cHex	H, H	5-FUR	H	
1-776	cHex	H, H	5-2THI	H	
1-777	cHex	H, H	5-3THI	H	
1-778	cHex	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H	
1-779	cHex	H, H	OXA	H	
1-780	cHex	H, H	5-MeMeIMD	H	
1-781	cHex	H, H	5-MeEtIMD	H	
1-782	cHex	H, H	5-EtEtIMD	H	
1-783	cHex	H, H	5-AllylEtIMD	H	
1-784	cHex	H, H	5-BnEtIMD	H	
1-785	cHex	H, H	5-PhEtIMD	H	
1-786	cHex	H, H	6-CN	H	
1-787	cHex	H, H	5,6-F2	H	
1-788	cHex	H, H	5,6-Cl2	H	
1-789	cHep	H, H	H	H	
1-790	MecPen	H, H	H	H	
1-791	Pyran	H, H	H	H	
1-792	Me, Me	H, H	H	H	HCl塩
1-793	Me, Me	H, H	5-F	H	HCl塩
1-794	Me, Me	H, H	5-Cl	H	HCl塩
1-795	Me, Me	H, H	H	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-796	Me, Me	H, H	5-F	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-797	Me, Me	H, H	5-Cl	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-798	Me, Me	H, H	H	H	HNO ₃ 塩
1-799	Me, Me	H, H	5-F	H	HNO ₃ 塩
1-800	Me, Me	H, H	5-Cl	H	HNO ₃ 塩
1-801	Me, Me	H, H	H	H	(COOH) ₂ 塩
1-802	Me, Me	H, H	5-F	H	(COOH) ₂ 塩
1-803	Me, Me	H, H	H	H	MsOH塩
1-804	Me, Me	H, H	5-F	H	MsOH塩
1-805	Me, Me	H, H	H	H	Salicylate
1-806	Me, Me	H, H	5-F	H	Salicylate
1-807	Me, Me	H, H	5-F	H	fumarate
1-808	Me, Et	H, H	H	H	HCl塩

1-809	Me, Et	H, H	5-F	H	HCl塩
1-810	Me, Et	H, H	5-Cl	H	HCl塩
1-811	Me, Et	H, H	H	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-812	Me, Et	H, H	5-F	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-813	Me, Et	H, H	5-Cl	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-814	Me, Et	H, H	H	H	HNO ₃ 塩
1-815	Me, Et	H, H	5-F	H	HNO ₃ 塩
1-816	Me, Et	H, H	5-Cl	H	HNO ₃ 塩
1-817	Me, Et	H, H	H	H	(COOH) ₂ 塩
1-818	Me, Et	H, H	5-F	H	(COOH) ₂ 塩
1-819	Me, Et	H, H	H	H	MsOH塩
1-820	Me, Et	H, H	5-F	H	MsOH塩
1-821	Me, Et	H, H	H	H	Salicylate
1-822	Me, Et	H, H	5-F	H	Salicylate
1-823	Me, Et	H, H	5-F	H	fumarate
1-824	Me, Pr	H, H	H	H	HCl塩
1-825	Me, Pr	H, H	5-F	H	HCl塩
1-826	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	HCl塩
1-827	Me, Pr	H, H	H	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-828	Me, Pr	H, H	5-F	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-829	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-830	Me, Pr	H, H	H	H	HNO ₃ 塩
1-831	Me, Pr	H, H	5-F	H	HNO ₃ 塩
1-832	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	HNO ₃ 塩
1-833	Me, Pr	H, H	H	H	(COOH) ₂ 塩
1-834	Me, Pr	H, H	5-F	H	(COOH) ₂ 塩
1-835	Me, Pr	H, H	H	H	MsOH塩
1-836	Me, Pr	H, H	5-F	H	MsOH塩
1-837	Me, Pr	H, H	H	H	Salicylate
1-838	Me, Pr	H, H	5-F	H	Salicylate
1-839	Me, Pr	H, H	5-F	H	fumarate
1-840	Me, Ph	H, H	H	H	HCl塩
1-841	Me, Ph	H, H	5-F	H	HCl塩
1-842	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	HCl塩
1-843	Me, Ph	H, H	H	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-844	Me, Ph	H, H	5-F	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-845	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	H ₂ SO ₄ 塩
1-846	Me, Ph	H, H	H	H	HNO ₃ 塩
1-847	Me, Ph	H, H	5-F	H	HNO ₃ 塩

1-848	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	HNO ₃ 塩
1-849	Me, Ph	H, H	H	H	(COOH) ₂ 塩
1-850	Me, Ph	H, H	5-F	H	(COOH) ₂ 塩
1-851	Me, Ph	H, H	H	H	MsOH塩
1-852	Me, Ph	H, H	5-F	H	MsOH塩
1-853	Me, Ph	H, H	H	H	Salicylate
1-854	Me, Ph	H, H	5-F	H	Salicylate
1-855	Me, Ph	H, H	5-F	H	fumarate
1-856	Me, Me	H, Me	H	H	
1-857	Me, Me	H, Me	5-F	H	
1-858	Me, Me	H, Me	5-Cl	H	
1-859	Me, Me	H, Et	H	H	
1-860	Me, Me	H, Et	5-F	H	
1-861	Me, Me	H, Et	5-Cl	H	
1-862	Me, Me	H, Pr	H	H	
1-863	Me, Me	H, Pr	5-F	H	
1-864	Me, Me	H, Pr	5-Cl	H	
1-865	Me, Me	Me, Me	H	H	
1-866	Me, Me	Me, Me	5-F	H	
1-867	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H	
1-868	Me, Et	H, Me	H	H	
1-869	Me, Et	H, Me	5-F	H	
1-870	Me, Et	H, Me	5-Cl	H	
1-871	Me, Pr	H, Me	H	H	
1-872	Me, Pr	H, Me	5-F	H	
1-873	Me, Pr	H, Me	5-Cl	H	
1-874	Me, Ph	H, Me	H	H	
1-875	Me, Ph	H, Me	5-F	H	
1-876	Me, Ph	H, Me	5-Cl	H	
1-877	Me, Ph	Me, Me	H	H	
1-878	Me, Ph	Me, Me	5-F	H	
1-879	Me, Ph	Me, Me	5-Cl	H	



化合物番号	R1, R2	R3, R4	R5	Xn	Ym
2-1	Me, Me	H, H	H	H	H
2-2	Me, Me	H, H	H	H	2-F
2-3	Me, Me	H, H	H	H	4-F
2-4	Me, Me	H, H	H	H	5-F
2-5	Me, Me	H, H	H	H	6-F
2-6	Me, Me	H, H	H	H	7-F
2-7	Me, Me	H, H	H	H	8-F
2-8	Me, Me	H, H	H	H	2-Cl
2-9	Me, Me	H, H	H	H	4-Cl
2-10	Me, Me	H, H	H	H	5-Cl
2-11	Me, Me	H, H	H	H	6-Cl
2-12	Me, Me	H, H	H	H	7-Cl
2-13	Me, Me	H, H	H	H	8-Cl
2-14	Me, Me	H, H	H	H	2-Me
2-15	Me, Me	H, H	H	H	4-Me
2-16	Me, Me	H, H	H	H	5-Me
2-17	Me, Me	H, H	H	H	6-Me
2-18	Me, Me	H, H	H	H	7-Me
2-19	Me, Me	H, H	H	H	8-Me
2-20	Me, Me	H, H	H	H	2-MeO
2-21	Me, Me	H, H	H	H	4-MeO
2-22	Me, Me	H, H	H	H	5-MeO
2-23	Me, Me	H, H	H	H	6-MeO
2-24	Me, Me	H, H	H	H	7-MeO
2-25	Me, Me	H, H	H	H	8-MeO
2-26	Me, Me	H, H	H	H	2-OH
2-27	Me, Me	H, H	H	H	4-OH
2-28	Me, Me	H, H	H	H	5-OH
2-29	Me, Me	H, H	H	H	6-OH
2-30	Me, Me	H, H	H	H	7-OH
2-31	Me, Me	H, H	H	H	8-OH
2-32	Me, Me	H, H	H	H	H
2-33	Me, Me	H, H	Me	H	H
2-34	Me, Me	H, H	Et	H	H
2-35	Me, Me	H, H	Pr	H	H
2-36	Me, Me	H, H	H	5-F	H
2-37	Me, Me	H, H	Me	5-F	H
2-38	Me, Me	H, H	Et	5-F	H
2-39	Me, Me	H, H	Pr	5-F	H
2-40	Me, Me	H, H	H	5-Cl	H
2-41	Me, Me	H, H	Me	5-Cl	H
2-42	Me, Me	H, H	Et	5-Cl	H

2-43	Me, Me	H, H	Pr	5-Cl	H
2-44	Me, Me	H, H	H	5-Br	H
2-45	Me, Me	H, H	Me	5-Br	H
2-46	Me, Me	H, H	Et	5-Br	H
2-47	Me, Me	H, H	Pr	5-Br	H
2-48	Me, Me	H, H	H	5-I	H
2-49	Me, Me	H, H	Me	5-I	H
2-50	Me, Me	H, H	Et	5-I	H
2-51	Me, Me	H, H	Pr	5-I	H
2-52	Me, Me	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-53	Me, Me	H, H	Me	5-MeEtIMD	H
2-54	Me, Me	H, H	Et	5-MeEtIMD	H
2-55	Me, Me	H, H	Pr	5-MeEtIMD	H
2-56	Me, Me	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-57	Me, Me	H, H	Me	5-EtEtIMD	H
2-58	Me, Me	H, H	Et	5-EtEtIMD	H
2-59	Me, Me	H, H	Pr	5-EtEtIMD	H
2-60	Me, Me	H, H	H	5-PrEtIMD	H
2-61	Me, Me	H, H	Me	5-PrEtIMD	H
2-62	Me, Me	H, H	Et	5-PrEtIMD	H
2-63	Me, Me	H, H	Pr	5-PrEtIMD	H
2-64	Me, Me	H, H	H	5,6-F2	H
2-65	Me, Me	H, H	Me	5,6-F2	H
2-66	Me, Me	H, H	Et	5,6-F2	H
2-67	Me, Me	H, H	Pr	5,6-F2	H
2-68	Me, Me	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-69	Me, Me	H, H	Me	5,6-Cl2	H
2-70	Me, Me	H, H	Et	5,6-Cl2	H
2-71	Me, Me	H, H	Pr	5,6-Cl2	H
2-72	Me, Et	H, H	H	H	H
2-73	Me, Et	H, H	H	5-F	H
2-74	Me, Et	H, H	H	5-Cl	H
2-75	Me, Et	H, H	H	5-Br	H
2-76	Me, Et	H, H	H	5-I	H
2-77	Me, Et	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-78	Me, Et	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-79	Me, Et	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-80	Me, Et	H, H	H	5,6-F2	H
2-81	Me, Et	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-82	Me, Pr	H, H	H	H	H
2-83	Me, Pr	H, H	H	5-F	H
2-84	Me, Pr	H, H	H	5-Cl	H
2-85	Me, Pr	H, H	H	5-Br	H

2-86	Me, Pr	H, H	H	5-I	H
2-87	Me, Pr	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-88	Me, Pr	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-89	Me, Pr	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-90	Me, Pr	H, H	H	5,6-F2	H
2-91	Me, Pr	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-92	Me, iPr	H, H	H	H	H
2-93	Me, iPr	H, H	H	5-F	H
2-94	Me, iPr	H, H	H	5-Cl	H
2-95	Me, iPr	H, H	H	5-Br	H
2-96	Me, iPr	H, H	H	5-I	H
2-97	Me, iPr	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-98	Me, iPr	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-99	Me, iPr	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-100	Me, iPr	H, H	H	5,6-F2	H
2-101	Me, iPr	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-102	Me, iBu	H, H	H	H	H
2-103	Me, iBu	H, H	H	5-F	H
2-104	Me, iBu	H, H	H	5-Cl	H
2-105	Me, iBu	H, H	H	5-Br	H
2-106	Me, iBu	H, H	H	5-I	H
2-107	Me, iBu	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-108	Me, iBu	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-109	Me, iBu	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-110	Me, iBu	H, H	H	5,6-F2	H
2-111	Me, iBu	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-112	Me, tBu	H, H	H	H	H
2-113	Me, tBu	H, H	H	5-F	H
2-114	Me, tBu	H, H	H	5-Cl	H
2-115	Me, tBu	H, H	H	5-Br	H
2-116	Me, tBu	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-117	Me, tBu	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-118	Me, iPen	H, H	H	H	H
2-119	Me, iPen	H, H	H	5-F	H
2-120	Me, iPen	H, H	H	5-Cl	H
2-121	Me, iPen	H, H	H	5-Br	H
2-122	Me, iPen	H, H	H	5-I	H
2-123	Me, iPen	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-124	Me, iPen	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-125	Me, iPen	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-126	Me, iPen	H, H	H	5,6-F2	H
2-127	Me, iPen	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-128	Et, Et	H, H	H	H	H

2-129	Et, Et	H, H	H	5-F	H
2-130	Et, Et	H, H	H	5-Cl	H
2-131	Et, Et	H, H	H	5-Br	H
2-132	Et, Et	H, H	H	5-I	H
2-133	Et, Et	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-134	Et, Et	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-135	Et, Et	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-136	Et, Et	H, H	H	5,6-F2	H
2-137	Et, Et	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-138	Me, CF3	H, H	H	H	H
2-139	Me, CF3	H, H	H	5-F	H
2-140	Me, CF3	H, H	H	5-Cl	H
2-141	Me, CF3	H, H	H	5-Br	H
2-142	Me, CF3	H, H	H	5-I	H
2-143	Me, CF3	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-144	Me, CF3	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-145	Me, CF3	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-146	Me, CF3	H, H	H	5,6-F2	H
2-147	Me, CF3	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-148	Me, CF3CH2	H, H	H	H	H
2-149	Me, CF3CH2	H, H	H	5-F	H
2-150	Me, CF3CH2	H, H	H	5-Cl	H
2-151	Me, CF3CH2	H, H	H	5-Br	H
2-152	Me, CF3CH2	H, H	H	5-I	H
2-153	Me, CF3CH2	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-154	Me, CF3CH2	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-155	Me, CF3CH2	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-156	Me, CF3CH2	H, H	H	5,6-F2	H
2-157	Me, CF3CH2	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-158	Me, Ph	H, H	H	H	H
2-159	Me, Ph	H, H	H	5-F	H
2-160	Me, Ph	H, H	H	5-Cl	H
2-161	Me, Ph	H, H	H	5-Br	H
2-162	Me, Ph	H, H	H	5-I	H
2-163	Me, Ph	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-164	Me, Ph	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-165	Me, Ph	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-166	Me, Ph	H, H	H	5,6-F2	H
2-167	Me, Ph	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-168	Me, FPh	H, H	H	H	H
2-169	Me, FPh	H, H	H	5-F	H
2-170	Me, FPh	H, H	H	5-Cl	H
2-171	Me, FPh	H, H	H	5-Br	H

2-172	Me, FPh	H, H	H	5-I	H
2-173	Me, FPh	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-174	Me, FPh	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-175	Me, FPh	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-176	Me, FPh	H, H	H	5,6-F2	H
2-177	Me, FPh	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-178	Me, ClPh	H, H	H	H	H
2-179	Me, ClPh	H, H	H	5-F	H
2-180	Me, ClPh	H, H	H	5-Cl	H
2-181	Me, ClPh	H, H	H	5-Br	H
2-182	Me, ClPh	H, H	H	5-I	H
2-183	Me, ClPh	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-184	Me, ClPh	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-185	Me, ClPh	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-186	Me, ClPh	H, H	H	5,6-F2	H
2-187	Me, ClPh	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-188	Ph, CF3	H, H	H	H	H
2-189	Ph, CF3	H, H	H	5-F	H
2-190	Ph, CF3	H, H	H	5-Cl	H
2-191	Ph, CF3	H, H	H	5-Br	H
2-192	Ph, CF3	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-193	Ph, CF3	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-194	ClCH2, FPh	H, H	H	H	H
2-195	ClCH2, FPh	H, H	H	5-F	H
2-196	ClCH2, FPh	H, H	H	5-Cl	H
2-197	ClCH2, FPh	H, H	H	5-Br	H
2-198	ClCH2, FPh	H, H	H	5-I	H
2-199	ClCH2, FPh	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-200	ClCH2, FPh	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-201	ClCH2, FPh	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-202	ClCH2, FPh	H, H	H	5,6-F2	H
2-203	ClCH2, FPh	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-204	ClCH2, ClPh	H, H	H	H	H
2-205	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-F	H
2-206	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-Cl	H
2-207	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-Br	H
2-208	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-I	H
2-209	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-MeMeIMD	H
2-210	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-MeEtIMD	H
2-211	ClCH2, ClPh	H, H	H	5-EtEtIMD	H
2-212	ClCH2, ClPh	H, H	H	5,6-F2	H
2-213	ClCH2, ClPh	H, H	H	5,6-Cl2	H
2-214	Me, Bn	H, H	H	5-F	H

2-215	Me, Bn	H, H	H	5-Cl	H	
2-216	Me, Bn	H, H	H	5-Br	H	
2-217	Me, Bn	H, H	H	5-I	H	
2-218	Me, Bn	H, H	H	5-MeMeIMD	H	
2-219	Me, Bn	H, H	H	5-MeEtIMD	H	
2-220	Me, Bn	H, H	H	5-EtEtIMD	H	
2-221	Me, Bn	H, H	H	5,6-F2	H	
2-222	Me, Bn	H, H	H	5,6-Cl2	H	
2-223	cPen	H, H	H	5-F	H	
2-224	cPen	H, H	H	5-Cl	H	
2-225	cPen	H, H	H	5-Br	H	
2-226	cPen	H, H	H	5-I	H	
2-227	cPen	H, H	H	5-MeMeIMD	H	
2-228	cPen	H, H	H	5-MeEtIMD	H	
2-229	cPen	H, H	H	5-EtEtIMD	H	
2-230	cPen	H, H	H	5,6-F2	H	
2-231	cPen	H, H	H	5,6-Cl2	H	
2-232	cHex	H, H	H	5-F	H	
2-233	cHex	H, H	H	5-Cl	H	
2-234	cHex	H, H	H	5-Br	H	
2-235	cHex	H, H	H	5-I	H	
2-236	cHex	H, H	H	5-MeMeIMD	H	
2-237	cHex	H, H	H	5-MeEtIMD	H	
2-238	cHex	H, H	H	5-EtEtIMD	H	
2-239	cHex	H, H	H	5,6-F2	H	
2-240	cHex	H, H	H	5,6-Cl2	H	
2-241	Me, Me	H, H	H	H	H	HCl塩
2-242	Me, Me	H, H	H	5-Cl	H	HCl塩
2-243	Me, Me	H, H	H	5-F	H	HCl塩
2-244	Me, Et	H, H	H	H	H	HCl塩
2-245	Me, Et	H, H	H	5-Cl	H	HCl塩
2-246	Me, Et	H, H	H	5-F	H	HCl塩
2-247	Me, Pr	H, H	H	H	H	HCl塩
2-248	Me, Pr	H, H	H	5-Cl	H	HCl塩
2-249	Me, Pr	H, H	H	5-F	H	HCl塩
2-250	Me, Ph	H, H	H	H	H	HCl塩
2-251	Me, Ph	H, H	H	5-Cl	H	HCl塩
2-252	Me, Ph	H, H	H	5-F	H	HCl塩
2-253	Me, Me	H, Me	H	H	H	
2-254	Me, Me	H, Me	H	5-Cl	H	
2-255	Me, Me	H, Me	H	5-F	H	
2-256	Me, Me	H, Et	H	H	H	
2-257	Me, Me	H, Et	H	5-Cl	H	

2-258	Me, Me	H, Et	H	5-F	H
2-259	Me, Me	H, Pr	H	H	H
2-260	Me, Me	H, Pr	H	5-Cl	H
2-261	Me, Me	H, Pr	H	5-F	H
2-262	Me, Me	Me, Me	H	H	H
2-263	Me, Me	Me, Me	H	5-Cl	H
2-264	Me, Me	Me, Me	H	5-F	H
2-265	Me, Et	H, Me	H	H	H
2-266	Me, Et	H, Me	H	5-Cl	H
2-267	Me, Et	H, Me	H	5-F	H
2-268	Me, Pr	H, Me	H	H	H
2-269	Me, Pr	H, Me	H	5-Cl	H
2-270	Me, Pr	H, Me	H	5-F	H
2-271	Me, Ph	H, Me	H	H	H
2-272	Me, Ph	H, Me	H	5-Cl	H
2-273	Me, Ph	H, Me	H	5-F	H

【0037】

上記の例示化合物中、好適な化合物は、化合物番号1-001、1-007、1-019、1-032、1-038、1-041、1-044、1-053、1-054、1-056、1-065、1-069、1-085、1-094、1-095、1-100、1-101、1-106、1-116、1-117、1-126、1-137、1-147、1-175、1-185、1-213、1-251、1-307、1-345、1-385、1-387、1-424、1-464、1-502、1-540、1-578、1-594、1-672、1-710、1-720、1-721、1-764、1-790、1-793、1-796、1-799、1-802、1-804、1-806、1-807、1-866、2-001、2-036又は2-040番の化合物であり、

より好適には、化合物番号1-032、1-038、1-044、1-054、1-056、1-085、1-116、1-117、1-147、1-185、1-385、1-387、1-424、1-464、1-502、1-540、1-594、1-672、1-793、1-804、1-806、1-807、1-866、2-036又は2-040番の化合物であり、

更により好適には、化合物番号1-032、1-044、1-056、1-085、1-117、1-147、1-185、1-387、1-424、1-464、1-502、1-540又は1-866番の化合物である。

【0038】

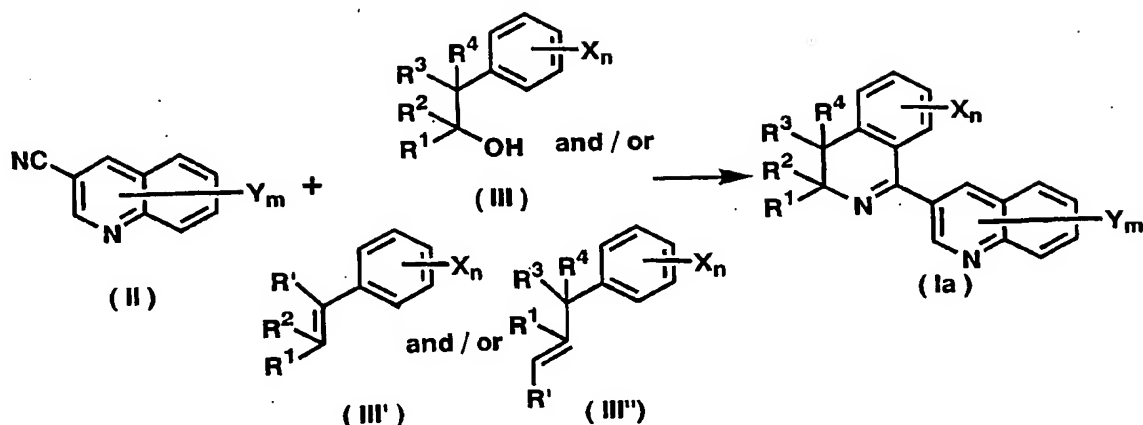
本発明の3-（ジヒドロイソキノリン-1-イル）キノリン化合物は、以下に記載するA及びB法により、3-（テトラヒドロイソキノリン-1-イル）キノリン化合物は、以下に記載するC法及びD法により製造することができる。

【0039】

(A法)

【0040】

【化3】



【0041】
上式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 n 、 Y 及び m は、前記と同意義を示し、 R' は、水素原子又はアルキル基を示す。

【0042】
A法は、ニトリル(II)と、アルコール(III)および/又はオレフィン(III')および/又はオレフィン(III'')を反応させて、本発明化合物(Ia)を製造する方法である。

【0043】
(A工程)
A工程は、化合物(II)を、溶媒中あるいは非溶媒中、酸の存在下、化合物(III)、化合物(III')および化合物(III'')のうちいずれか1種か、あるいはこれらの混合物と反応することにより、本発明化合物(Ia)を製造する工程である。

【0044】
用いられる化合物(III)、化合物(III')および化合物(III'')の総量は、化合物(II)1モルに対し、通常、1~6モルであり、好適には、1.1~3.0モルである。

【0045】
本工程で溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；又は、ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジブチルエーテル等のエーテル類であり得、好適には、炭化水素類、又は、ハロゲン化炭化水素類であり、更に好適には、ベンゼン又はジクロロエタンである。

【0046】
本工程で用いられる酸は、通常のリッター反応において酸として使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、硫酸、蟻酸、リン酸、過塩素酸のような無機酸；ベンゼンスルホン酸、トルエンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸のようなスルホン酸；又は、四塩化錫、トリフルオロホウ素のようなルイス酸であり得、好適には、無機酸又はスルホン酸であり、更に好適には、硫酸又はトリフルオロメタンスルホン酸である。

【0047】
用いられる酸の量は、化合物(II)1モルに対し、通常、1~20モルであり、好適には、1.1~15モルである。

【0048】
反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒などにより異なるが、通常、 -20°C ~ 100°C であり、好適には、 0°C ~ 80°C である。

【0049】

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度などにより異なるが、通常、15分間～120時間であり、好適には、30分間～72時間である。

【0050】

上記A法の出発原料である3-キノリンカルボニトリル化合物(II)は公知化合物であるか、又は公知の方法[例えば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー J. Med. Chem., 22巻816頁(1979年)に記載された方法]に準じて製造することができる。

【0051】

本工程に使用されるアルコール化合物(III)は公知化合物であるか、又は公知の方法[例えば、テトラヘドロン Tetrahedron, 55巻4595頁(1999年)に記載された方法]に準じて製造することができる。

【0052】

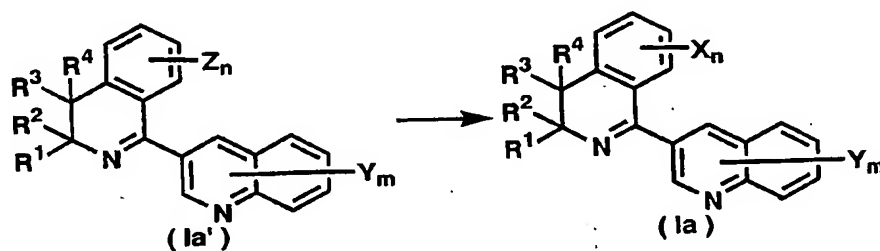
本工程に使用されるオレフィン化合物(III')およびオレフィン化合物(III'')は公知化合物であるか、又は公知の方法[例えば、プレタン・デ・ラ・ソシエテ・キミケ・デ・フランス(Bull. Soc. Chim. Fr.)2巻633頁(1935年)に記載されたように酸でアルコールを脱水する方法、テトラヘドロン・レターズ(Tetrahedron Lett.)35巻4129頁(1994年)やジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J. Org. Chem.)47巻2928頁(1982年)に記載されたようにアルコールに脱離基をつけて脱水する方法]に準じて製造することができる。

【0053】

(B法)

【0054】

【化4】



【0055】

上式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 n 、 Y 及び m は、前記と同意義を示し、 Z は、臭素、又はヨウ素を示す。

【0056】

B法は、本発明化合物(Ia')($X=Z$)とカップリング反応をすることにより、本発明化合物(Ia)を製造する方法である。

【0057】

(B工程)

B工程は、化合物(Ia')を、溶媒中、塩基の存在下あるいは非存在下、カップリング化剤と金属触媒の存在下で反応することにより、本発明化合物(Ia)を製造する工程である。

【0058】

本工程で用いられるカップリング化剤は、通常のカップリング反応に使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、有機マグネシウム、有機亜鉛、有機アルミニウム、有機ジルコニウム、有機錫、有機ホウ素、有機水銀、有機リチウム、有機銅などの有機金属であり得、好適には有機錫、有機ホウ酸エステル、又は有機銅である。

【0059】

用いられるカップリング化剤の量は、化合物 (Ia') 1 モルに対し、通常、1～6 モルであり、好適には、1. 1～3 モルである。

【0060】

本工程で用いられる金属触媒は、通常のカップリング反応に使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、ニッケル、パラジウム、銅、クロムなどの金属塩、又は金属錯体であり得、好適にはニッケルアセチルアセトネート、テトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム、又はヨウ化銅である。

【0061】

用いられるカップリング化剤の量は、化合物 (Ia') 1 モルに対し、通常、1～6 モルであり、好適には、1. 1～3 モルである。

【0062】

本工程で用いられる溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；又は、ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、ジブチルエーテル等のエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のようなアミド類であり得、好適には、炭化水素類であり、更に好適には、トルエンである。

【0063】

本工程で塩基を用いる場合、用いられる塩基は、通常の反応において塩基として使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウムのようなアルカリ金属水酸化物若しくはアルカリ土類金属水酸化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム *t*-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、*N*-メチルモルホリン、ピリジン、4-(*N*, *N*-ジメチルアミノ)ピリジン、*N*, *N*-ジメチルアニリン、*N*, *N*-ジエチルアニリン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノナ-5-エン、1, 4-ジアザビシクロ [2. 2. 2] オクタン (DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン (DBU) のような有機塩基類であり得、好適には、アルカリ金属炭酸塩、有機塩基類、又はアルカリ金属水酸化物であり、更に好適には炭酸ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、又は水酸化ナトリウムである。

【0064】

用いられる塩基の量は、化合物 (Ia') 1 モルに対し、通常、1～6 モルであり、好適には、1. 1～3 モルである。

【0065】

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒などにより異なるが、通常、0℃～200℃であり、好適には、20℃～180℃である。

【0066】

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度などにより異なるが、通常、1時間～120時間であり、好適には、3時間～72時間である。

【0067】

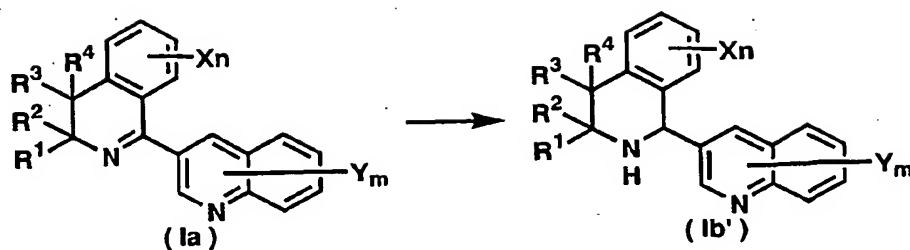
上記B法の出発原料である化合物 (Ia') は上記A法で製造することができる。

【0068】

(C法)

【0069】

【化5】



【0070】

上式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 n 、 Y 及び m は、前記と同意義を示す。

【0071】

C法は、本発明化合物(Ia)を還元することにより、本発明化合物(Ib') ($R^5 = H$)を製造する方法である。

【0072】

(C工程)

C工程は、化合物(Ia)を、溶媒中、還元反応により、本発明化合物(Ib')を製造する工程である。

【0073】

本工程で用いられる還元反応は、イミンを還元するのに使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、パラジウム炭素、酸化白金、ラネーニッケル等を触媒とする水素添加反応；亜鉛-酢酸、錫-塩酸のような金属-酸の組み合わせによる反応；水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウムのような金属水素化物の反応であり得、好適には、金属水素化物の反応であり、更に好適には、水素化ホウ素ナトリウムである。

【0074】

用いられる還元剤の量は、化合物(Ia) 1モルに対し、通常、0.5～20モルであり、好適には、0.5～10モルである。

【0075】

本工程で溶媒を用いる場合、用いられる溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；メタノール、エタノール、2-プロパノール等のアルコール類；酢酸、塩酸、硫酸等の酸類；又は、ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジブチルエーテル等のエーテル類であり得、好適には、アルコール類であり、更に好適には、エタノールである。

【0076】

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒などにより異なるが、通常、0℃～200℃であり、好適には、20℃～180℃である。

【0077】

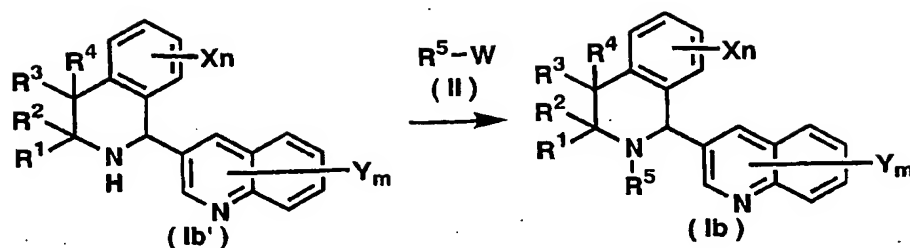
反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度などにより異なるが、通常、1時間～120時間であり、好適には、3時間～72時間である。

【0078】

(D法)

【0079】

【化6】



【0080】

上式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X 、 n 、 Y 及び m は、前記と同意義を示し、 W はハロゲン原子を示す。

【0081】

D法は、本発明化合物(Ib') ($\text{R}^5 = \text{H}$)をアルキル化することにより、本発明化合物(Ib)を製造する方法である。

【0082】

(D工程)

D工程は、化合物(Ib')を、溶媒中、塩基の存在下、ハロゲン化アルキル(II)により、本発明化合物(Ib)を製造する工程である。
用いられる化合物(II)の量は、化合物(Ib') 1モルに対し、通常、1~130モルであり、好適には、1.1~10モルである。

【0083】

本工程で塩基を用いる場合、用いられる塩基は、通常の反応において塩基として使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウムのようなアルカリ金属水酸化物；又はアルカリ土類金属水酸化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、 N -メチルモルホリン、ピリジン、4-(N , N -ジメチルアミノ)ピリジン、 N , N -ジメチルアニリン、 N , N -ジエチルアニリン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノナ-5-エン、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2]オクタン(DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン(DBU)のような有機塩基類；又は、ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドのような有機金属類であり得、好適には、アルカリ金属炭酸塩であり、更に好適には、炭酸カリウムである。

【0084】

用いられる塩基の量は、化合物(IV) 1モルに対し、通常、1~30モルであり、好適には、1.1~10モルである。

【0085】

本工程で用いられる溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン等の炭化水素類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、テトラクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド(HMPA)等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類；アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類；又は、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類であり得、好適には、ケトン類であり、更に好適には、アセトンである。

出証特2005-3015070

【0086】

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒などにより異なるが、通常、 -20°C ～ 150°C であり、好適には、 0°C ～ 40°C である。

【0087】

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度などにより異なるが、通常、10分間～120時間であり、好適には、30分間～72時間である。

【0088】

上記各反応終了後、各反応の目的化合物は、常法に従って反応混合物から採取することができる。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。

【0089】

得られた目的化合物は、必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

【0090】

本発明の化合物 (Ia)、又は、(Ib) の塩を製造する工程は、各工程で製造した化合物 (Ia)、又は、(Ib) を含む反応混合物の抽出濃縮物、又は、化合物 (Ia)、又は、(Ib) を適当な溶媒に溶解させた液に酸を加えることによって行われる。

【0091】

反応に使用される酸は、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸のようなハロゲン化水素酸、硝酸、過塩素酸、硫酸、リン酸等の無機酸；メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、エタンスルホン酸のような低級アルキルスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のようなアリールスルホン酸、コハク酸、シュウ酸等の有機酸塩；及びサッカリンのような有機酸アミド化合物を挙げることができる。

【0092】

酸は、通常1当量乃至10当量用いられ、好適には1当量乃至5当量である。

【0093】

反応に使用される溶媒は、本反応を阻害しない限り特に限定は無いが、好適には、エーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類を挙げることができる。

【0094】

反応温度は、 -20°C ～ 50°C であり、好適には -10°C ～ 30°C である。

【0095】

反応時間は、用いられる溶媒の種類及び温度などにより異なるが、通常10分間～1時間である。

【0096】

生成した塩は常法によって単離される。即ち、結晶として析出する場合は濾取によって、水溶性の場合には、有機溶媒と水との分液によって水溶液として単離される。

【0097】

本発明化合物は、有害生物防除剤の有効成分として有用である。例えば農園芸用殺菌剤としては各種の植物病原菌によって引き起こされる病害に対し優れた防除効果を示す。特にイネいもち病、穂枯病、アズキ、トマト、キュウリ及びインゲンの灰色かび病、菌核病、タマネギ白斑葉枯病、コムギの雪腐病、うどんこ病、リンゴのモニリア病、斑点落葉病、茶のたんそ病、ナシの赤星病、黒斑病、ブドウの黒とう病、カンキツの黒点病等の各種病害などに対して優れた防除効果を示す。本発明化合物は優れた治療効果を有することから感染後の処理による病害防除が可能である。

【0098】

本発明化合物の使用に際しては、従来の農薬製剤の場合と同様に、補助剤と共に、乳剤、粉剤、水和剤、液剤、粒剤、懸濁製剤などの種々の形態に製剤することができる。これ

らの製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水などの希釈剤で所定濃度に希釈して使用することができる。

【0099】

用いられる補助剤としては、担体、乳化剤、懸濁剤、分散剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、増粘剤、安定剤などが挙げられ、必要に応じ適宜添加することができる。

【0100】

用いられる担体は、固体担体と液体担体に分けられ、固体担体は、澱粉、砂糖、セルロース粉、シクロデキストリン、活性炭、大豆粉、小麦粉、もみがら粉、木粉、魚粉、粉乳などの動植物性粉末；又は、タルク、カオリン、ペントナイト、有機ペントナイト、炭酸カルシウム、硫酸カルシウム、重炭酸ナトリウム、ゼオライト、珪藻土、ホワイトカーボン、クレー、アルミナ、シリカ、硫黄粉末などの鉱物性粉末などであり得、液体担体は、水；大豆油、棉実油、トウモロコシ油などの動植物油；エチルアルコール、エチレングリコールなどのアルコール類；アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類；ジオキサン、テトラヒドロフランなどのエーテル類；ケロシン、灯油、流動パラフィン、キシレン、トリメチルベンゼン、テトラメチルベンゼン、シクロヘキサン、ソルベントナフサなどの脂肪族／芳香族炭化水素類；クロホルム、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミドなどの酸アミド類；酢酸エチルエステル、脂肪酸のグリセリンエステルなどのエステル類；アセトニトリルなどのニトリル類；ジメチルスルホキシドなどの含硫化合物類；又は、N-メチルピロリドンなどであり得る。

【0101】

本発明化合物と補助剤との配合質量比は、通常 0.05 : 99.95 ~ 90 : 10 であり、好適には 0.2 : 99.8 ~ 80 : 20 である。

【0102】

本発明化合物の使用濃度又は使用量は、対象作物、使用方法、製剤形態、施用量などの違いによって異なるが、莖葉処理の場合、有効成分当たり普通 0.1 ~ 10000 ppm であり、好適には 1 ~ 1000 ppm であり、土壌処理の場合には、普通 10 ~ 100000 g / ha であり、好適には 100 ~ 10000 g / ha である。

本発明化合物は必要に応じて他の農薬、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、誘引剤、殺線虫剤、

【0103】

殺菌剤、抗ウイルス剤、除草剤、植物生長調整剤などと混用又は併用することができ、好適には、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺菌剤である。

【0104】

用いられる殺虫剤、殺ダニ剤又は殺線虫剤は、例えば O- (4-プロモ-2-クロロフェニル) O-エチル S-プロピルホスホロチオエート (一般名: プロフェノホス)、O- (2, 2-ジクロロビニル) O, O-ジメチルホスフェート (一般名: ジクロロボス)、O-エチル O- {3-メチル-4- (メチルチオ) フェニル} N-イソプロピルホスホアミデート (一般名: フェナミホス)、O, O-ジメチル O- (4-ニトロ-m-トリル) ホスホロチオエート (一般名: フェニトロチオン)、O-エチル O- (4-ニトロフェニル) フェニルホスホノチオエート (一般名: EPN)、O, O-ジエチル O- (2-イソプロピル-6-メチルピリミジン-4-イル) ホスホロチオエート (一般名: ダイアジノン)、O, O-ジメチル O- (3, 5, 6-トリクロロ-2-ピリジル) ホスホロチオエート (一般名: クロルピリホスメチル)、O, S-ジメチル N-アセチルホスホアミドチオエート (一般名: アセフェート)、O- (2, 4-ジクロロフェニル) O-エチル S-プロピルホスホロジチオエート (一般名: プロチオホス) のような有機リン酸エステル系化合物；1-ナフチル N-メチルカーバメート (一般名: カルバリル)、2-イソプロポキシフェニル N-メチルカーバメート (一般名: プロボキシル)、2-メチル-2- (メチルチオ) プロピオンアルデヒド O-メチルカルバモイルオキシム (一般名: アルジカルブ)、2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチルベンゾフラン-7-イル N-メチルカーバメート (一般名: カルボフラン)、ジメチル N, N'- (チ

オビス | (メチルイミノ) カルボニルオキシ | } ビスエタンイミドチオエート (一般名:
 チオジカルブ)、S-メチル N- (メチルカルバモイルオキシ) チオアセトイミデート
 (一般名: メソミル)、N, N-ジメチル-2-メチルカルバモイルオキシイミノ-2-
 (メチルチオ) アセトアミド (一般名: オキサミル)、2- (エチルチオメチル) フェニ
 ル N-メチルカーバメート (一般名: エチオフエンカルブ)、2-ジメチルアミノ-5
 , 6-ジメチルピリミジン-4-イル N, N-ジメチルカーバメート (一般名: ピリミ
 カープ)、2-sec-ブチルフェニル N-メチルカーバメート (一般名: フェノブカ
 ルブ) のようなカーバメート系化合物; S, S'-2-ジメチルアミノトリメチレンビス
 (チオカーバメート) (一般名: カルタップ)、N, N-ジメチル-1, 2, 3-トリチ
 アン-5-イルアミン (一般名: チオシクラム) のようなネライストキシン化合物; 2,
 2, 2-トリクロロ-1, 1-ビス (4-クロロフェニル) エタノール (一般名: ジコホ
 ル)、4-クロロフェニル-2, 4, 5-トリクロロフェニルスルホン (一般名: テトラ
 ジホン) のような有機塩素系化合物; ビス | トリス (2-メチル-2-フェニルプロピル
) チン | オキシド (一般名: 酸化フェンブタスズ) のような有機金属系化合物; (RS)
 - α -シアノ-3-フェノキシベンジル (RS)-2- (4-クロロフェニル)-3-メ
 チルブチレート (一般名: フェンバレレート)、3-フェノキシベンジル (1RS)-シ
 ス, トランス-3- (2, 2-ジクロロビニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカル
 ボキシレート (一般名: ペルメトリン)、(RS)- α -シアノ-3-フェノキシベンジ
 ル (1RS)-シス, トランス-3- (2, 2-ジクロロビニル)-2, 2-ジメチルシ
 クロプロパンカルボキシレート (一般名: シペルメトリン)、(S)- α -シアノ-3-
 フェノキシベンジル (1R)-シス-3- (2, 2-ジブromoビニル)-2, 2-ジメチ
 ルシクロプロパンカルボキシレート (一般名: デルタメトリン)、(RS)- α -シアノ
 -3-フェノキシベンジル (1RS)-シス, トランス-3- (2-クロロ-3, 3, 3-
 -トリフルオロプロペニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (一般
 名: シハロトリン)、4-メチル-2, 3, 5, 6-テトラフルオロベンジル-3- (2-
 クロロ-3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロペニル)-2, 2-ジメチルシクロプロ
 パンカルボキシレート (一般名: テフルトリン)、2- (4-エトキシフェニル)-2-
 メチルプロピル 3-フェノキシベンジルーエテル (一般名: エトフェンブックス) の
 ようなピレスロイド系化合物; 1- (4-クロロフェニル)-3- (2, 6-ジフルオロ
 ベンゾイル) ウレア (一般名: ジフルベンズロン)、1- [3, 5-ジクロロ-4- (3-
 クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ) フェニル]-3- (2, 6-
 ジフルオロベンゾイル) ウレア (一般名: クロルフアラズロン)、1- (3, 5-ジクロ
 ロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-3- (2, 6-ジフルオロベンゾイル) ウレア (一
 般名: テフルベンズロン) のようなベンゾイルウレア系化合物; イソプロピル (2E,
 一般名: メトプレン) のような幼若ホルモン様化合物; 2-t-ブチル-5- (4-t-ブ
 チルベンジルチオ)-4-クロロ-3 (2H)-ピリダジノン (一般名: ピリダベン) の
 ようなピリダジノン系化合物; t-ブチル 4- { (1, 3-ジメチル-5-フェノキシ
 ピラゾール-4-イル) メチレンアミノオキシメチル | ベンゾエート (一般名: フェンピ
 ロキシメート) のようなピラゾール系化合物; 1- (6-クロロ-3-ピリジルメチル)
 -N-ニトロ-イミダゾリジン-2-イリデンアミン (一般名: イミダクロプリド) など
 のニトロ系化合物; ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化
 合物、ヒドラジン系化合物、また、その他の化合物として、2-tert-ブチルイミノ
 -3-イソプロピル-5-フェニル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 3, 5-
 -チアジアジン-4-オン (一般名: プロフェジン)、トランス- (4-クロロフェニ
 ル)-N-シクロヘキシル-4-メチル-2-オキソチアゾリジノン-3-カルボキサミ
 ド (一般名: ヘキシチアゾクス)、N-メチルビス (2, 4-キシリルイミノメチル) ア
 ミン (一般名: アミトラズ)、N'- (4-クロロ- α -トリル)-N, N-ジメチルホ
 ルムアミジン (一般名: クロルジメホルム)、(4-エトキシフェニル)- {3- (4-
 フルオロ-3-フェノキシフェニル) プロピル | (ジメチル) シラン (一般名: シラフル

オフエン)のような化合物であり得る。更に、本発明化合物は、BT剤、昆虫病原ウイルス剤などのような微生物農薬、アペルメクチン、ミルベマイシンのような抗生物質などと、混用、併用することもできる。

【0105】

用いられる殺菌剤は、例えば、2-アニリノ-4-メチル-6-(1-プロピニル)ピリミジン(一般名:メバニピリム)、4, 6-ジメチル-N-フェニル-2-ピリミジナミン(一般名:ピリメサニル)のようなピリミジナミン系化合物; 1-(4-クロロフェノキシ)-3, 3-ジメチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタノン(一般名:トリアジメホン)、1-(ビフェニル-4-イルオキシ)-3, 3-ジメチル-1-(1H, 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(一般名:ピテルタノール)、1-{N-(4-クロロ-2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロポキシアセトイミドイル}イミダゾール(一般名:トリフルミゾール)、1-{2-(2, 4-ジクロロフェニル)-4-エチル-1, 3-ジオキソラン-2-イルメチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール(一般名:エタコナゾール)、1-{2-(2, 4-ジクロロフェニル)-4-プロピル-1, 3-ジオキソラン-2-イルメチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール(一般名:プロピコナゾール)、1-{2-(2, 4-ジクロロフェニル)ペンチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール(一般名:ペンコナゾール)、ビス(4-フルオロフェニル)(メチル)(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シラン(一般名:フルシラゾール)、2-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)ヘキサニトリル(一般名:マイクロブタニル)、(2RS, 3RS)-2-(4-クロロフェニル)-3-シクロプロピル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(一般名:シプロコナゾール)、(RS)-1-(4-クロロフェニル)-4, 4-ジメチル-3-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)ペンタン-3-オール(一般名:タプロコナゾール)、(RS)-2-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ヘキサン-2-オール(一般名:ヘキサコナゾール)、(2RS, 5RS)-5-(2, 4-ジクロロフェニル)テトラヒドロ-5-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)-2-フリル2, 2, 2-トリフルオロエチルエーテル(一般名:ファコナゾールシス)、N-プロピル-N-{2-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)エチル}イミダゾール-1-カルボキサミド(一般名:プロクローラズ)、2-(4-フルオロフェニル)-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-3-トリメチルシリルプロパン-2-オール(一般名:シメコナゾール)のようなアゾール系化合物; 6-メチル-1, 3-ジチオ[4, 5-b]キノキサリン-2-オン(一般名:キノメチオネート)のようなキノキサリン系化合物; マンガニーズエチレンビス(ジチオカーバメート)の重合体(一般名:マンネブ)、ジンクエチレンビス(ジチオカーバメート)の重合体(一般名:ジネブ)、ジンク(亜鉛)とマンガニーズエチレンビス(ジチオカーバメート)(マンネブ)の錯化合物(一般名:マンゼブ)、ジジンクビス(ジメチルジチオカーバメート)エチレンビス(ジチオカーバメート)(一般名:ポリカーバメート)、ジンクプロピレンビス(ジチオカーバメート)の重合体(一般名:プロピネブ)のようなジチオカーバメート系化合物; 4, 5, 6, 7-テトラクロロフタリド(一般名:フサライド)、テトラクロロイソフタロニトリル(一般名:クロロタロニル)、ペンタクロロニトロベンゼン(一般名:キントゼン)のような有機塩素系化合物; メチル 1-(ブチルカルバモイル)ベンズイミダゾール-2-イルカーバメート(一般名:ベノミル)、ジメチル4, 4'-(o-フェニレン)ビス(3-チオアロファネート)(一般名:チオファネートメチル)、メチルベンズイミダゾール-2-イルカーバメート(一般名:カーペンダジム)のようなベンズイミダゾール系化合物; 3-クロロ-N-(3-クロロ-2, 6-ジニトロ-4- α , α , α -トリフルオロトリル)-5-トリフルオロメチル-2-ピリジナミン(一般名:フルアジナム)のようなピリジナミン系化合物; 1-(2-シアノ-2-メトキシイミノアセチル)-3-エチル尿素(一般名:シモキサニル)のようなシアノアセトアミド系化合物; メチル N-(2-メトキシアセチル

) -N-(2, 6-キシリル) -DL-アラニネート (一般名: メタラキシル)、2-メ
 トキシ-N-(2-オキソ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル) アセト-2', 6'-
 キシリジド (一般名: オキサジキシル)、(±)- α -2-クロロ-N-(2, 6-キシ
 リルアセトアミド)- γ -ブチロラクトン (一般名: オフレース)、メチル N-フェニ
 ルアセチル-N-(2, 6-キシリル) -DL-アラニネート (一般名: ペナラキシル)
 、メチル N-(2-フロイル) -N-(2, 6-キシリル) -DL-アラニネート (一
 般名: フララキシル)、(±)- α -[N-(3-クロロフェニル) シクロプロパンカル
 ボキサミド]- γ -ブチロラクトン (一般名: シプロフラン) のようなフェニルアミド系
 化合物; N-ジクロロフルオロメチルチオ-N', N'-ジメチル-N-フェニルスル
 ファミド (一般名: ジクロフルアニド) のようなスルフェン酸系化合物; 水酸化第二銅 (一
 般名: 水酸化第二銅)、銅 8-キノリノレート (一般名: 有機銅) のような銅系
 化合物; 5-メチルイソキサゾール-3-オール (一般名: ヒドロキシイソキサゾール)
 のようなイソキサゾール系化合物; アルミニウムトリス (エチルホスホネート) (一般名
 : ホセチルアルミニウム)、O-2, 6-ジクロロ-p-トリル-O, O-ジメチルホス
 ホロチオエート (一般名: トルクロホス-メチル)、S-ベンジル O, O-ジイソプロ
 ピルホスホロチオエート、O-エチル S, S-ジフェニルホスホロジチオエート、アル
 ミニウムエチルハイドロゲンホスホネートのような有機リン系化合物; N-(トリクロ
 メチルチオ) シクロヘキサ-4-エン-1, 2-ジカルボキシミド (一般名: キャプタン
)、N-(1, 1, 2, 2-テトラクロロエチルチオ) シクロヘキサ-4-エン-1, 2-
 ジカルボキシミド (一般名: キャプタホル)、N-(トリクロロメチルチオ) フタルイ
 ミド (一般名: フォルベット) のようなN-ハロゲノチオアルキル系化合物; N-(3,
 5-ジクロロフェニル)-1, 2-ジメチルシクロプロパン-1, 2-ジカルボキシミド
 (一般名: プロシミドン)、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-N-イソプロピル-2
 , 4-ジオキソイミダゾリジン-1-カルボキサミド (一般名: イプロジオン)、(RS
)-3-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-メチル-5-ビニル-1, 3-オキサゾリ
 ジン-2, 4-ジオン (一般名: ビンクロゾリン) のようなジカルボキシイミド系化合物
 ; α , α , α -トリフルオロ-3'-イソプロボキシ-オ-トルアニリド (一般名: フル
 トラニル)、3'-イソプロボキシ-オ-トルアニリド (一般名: メプロニル) のような
 ベンズアニリド系化合物; N, N'-[ピペラジン-1, 4-ジイルビス (トリクロ
 ロメチル) メチレン] ジホルムアミド (一般名: トリホリン) のようなピペラジン系化
 合物; 2', 4'-ジクロロ-2-(3-ピリジル) アセトフェノン O-メチルオキシム
 (一般名: ピリフェノックス) のようなピリジン系化合物; (±)-2, 4'-ジクロ
 ロ- α -(ピリミジン-5-イル) ベンズヒドリルアルコール (一般名: フェナリモル)、
 (±)-2, 4'-ジフルオロ- α -(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチ
 ル) ベンズヒドリルアルコール (一般名: フルトリアフォル) のようなカルビノール系化
 合物; (RS)-1-[3-(4-t-ブチルフェニル)-2-メチルプロピル] ピペリ
 ジン (一般名: フェンプロピディン) のようなピペリジン系化合物; (±)-シス-4-
 [3-(4-t-ブチルフェニル)-2-メチルプロピル]-2, 6-ジメチルモルフォ
 リン (一般名: フェンプロピモルフ) のようなモルフォリン系化合物; トリフェニルチン
 ヒドロキシド (一般名: フェンチンヒドロキシド)、トリフェニルチンアセテート (一般
 名: フェンチンアセテート) のような有機スズ系化合物; 1-(4-クロロベンジル)-
 1-シクロペンチル-3-フェニルウレア (一般名: ペンシキュロン) のような尿素系化
 合物; (E, Z) 4-[3-(4-クロロフェニル)-3-(3, 4-ジメトキシフェニ
 ル) アクリロイル] モリフォリン (一般名: ジメトモルフ) のようなシンナミック酸系化
 合物; イソプロピル 3, 4-ジエトキシカルバニレート (一般名: ジエトフェンカル
) のようなフェニルカーバメート系化合物; 3-シアノ-4-(2, 2-ジフルオロ-1
 , 3-ベンゾジオキソール-4-イル) ピロール (一般名: フルジオキソニル)、3-(
 2', 3'-ジクロロフェニル)-4-シアノ-ピロール (一般名: フェンビクロニル)
 のようなシアノピロール系化合物であり得る。

【実施例】

出証特2005-3015070

【0106】

以下に、実施例、製剤例及び試験例を挙げて本発明化合物を具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0107】

実施例 1

6'-メチル-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ [シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-772 番) (A 工程)

キノリン-3-カルボニトリル (154 mg、1.0 ミリモル) のベンゼン (1.0 mL) 溶液に、氷冷下、硫酸 (0.4 mL) 及び 1-(3-メチルベンジル) シクロヘキサノール (204 mg、1.0 ミリモル) を加え、80℃で1時間攪拌した後、水に注加し、酢酸エチルで抽出して得られた残渣をクロマトグラフィーに付し、目的物 180 mg (収率 73%) を得た。

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.51-1.85 (10H, m), 2.40 (3H, s), 2.81 (2H, s), 7.02-7.14 (3H, m), 7.57 (1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.86 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.36 (1H, s), 9.16 (1H, s). MS m/z : 340(M^+), 325, 311, 297, 284, 244, 142, 128.

【0108】

実施例 2

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-32 番) (A 工程)

1-フルオロ-2-メチルプロペン-1-イル) ベンゼンと 1-フルオロ-2-メチルプロペン-2-イル) ベンゼンの約 4 対 7 の混合物 (87.3 mg、0.58 ミリモル) 及びキノリン-3-カルボニトリル (89.6 mg、0.58 ミリモル) のジクロロエタン (0.58 mL) 溶液に、氷冷下、トリフルオロメタンスルホン酸 (0.52 mL) を加え、室温で 18 時間攪拌した後、水に注加し、酢酸エチルで抽出して得られた残渣をクロマトグラフィーに付し、目的物 82.2 mg (収率 47%) を得た。

融点: 97~100℃。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.36 (6H, s), 2.89 (2H, s), 7.03 (1H, dd, $J=1.4, 6.9\text{Hz}$), 7.18-7.24 (2H, m), 7.60 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.77 (1H, ddd, $J=1.3, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.09 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 304(M^+), 303, 289, 248, 156.

【0109】

実施例 3

3-(5-アセチル-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-114 番) (B 工程)

3-(5-ブロモ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (806 mg、2.2 ミリモル) のトルエン (0.9 mL) 溶液に、トリブチル 1-エトキシビニル) スズ (0.85 mL、2.4 ミリモル)、及びジクロロビストリフェニルフォスフィンパラジウム (15.8 mg、0.022 ミリモル) を加え、100℃で3時間攪拌した後、希塩酸を加えいったん酸性にし、アンモニア水でアルカリ性にし、濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をクロマトグラフィーに付し、目的物 647 mg (収率 89%) を得た。

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (6H, s), 2.67 (3H, s), 3.13 (2H, s), 7.32 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.37 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.60 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.78 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.82 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.35 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.06 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 328(M^+), 313, 285.

【0110】

実施例 4

3-(3,3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(化合物番号2-1番)(C工程)

3-(3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(650mg、2.7ミリモル)のエタノール(30mL)溶液に、水素化ホウ素ナトリウム(370mg、1.0ミリモル)を加え、3時間加熱還流した後、この反応溶液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出して得られた残渣をクロマトグラフィーに付し、目的物420mg(収率54%)を得た。

融点: 117~122℃。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.24 (3H, s), 1.29 (3H, s), 2.65 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 2.98 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 5.33 (1H, s), 6.70 (1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 6.99-7.03 (1H, m), 7.12 (2H, s), 7.49 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.65 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.74 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.08 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.09 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.85 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).
MS m/z : 288(M^+), 273, 230, 202, 160, 144, 128, 155.

【0111】

実施例 5

3-(2,3,3-トリメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(化合物番号2-33番)(D工程)

3-(3,3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(144mg、0.5ミリモル)のアセトン(2mL)溶液に、炭酸カリウム(500mg、3.6ミリモル)およびヨウ化メチル(0.33mL、5.0ミリモル)を加え、室温で3時間攪拌した後、濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をクロマトグラフィーに付し、目的物60mg(収率40%)を得た。

融点: 116~118℃。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.00 (3H, s), 1.35 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.61 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 3.23 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 4.58 (1H, s), 6.64 (1H, d, $J=7.9\text{Hz}$), 6.93 (1H, t, $J=7.9\text{Hz}$), 7.06-7.08 (2H, m), 7.51 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.65 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.78 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.07 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.08 (1H, d, $J=7.9\text{Hz}$), 8.84 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).
MS m/z : 302(M^+), 287, 265, 230, 174, 158, 149, 128, 115.

【0112】

実施例1~5と同様にして、以下の化合物を合成した。

【0113】

実施例 6

3-(3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(化合物番号1-1番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.86 (2H, s), 7.20-7.27 (3H, m), 7.37-7.40 (1H, m), 7.56 (1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.74 (1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.86 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.11 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).
MS m/z : 286(M^+), 285, 271, 230, 128, 115.

【0114】

実施例 7

3-(3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)-8-フルオロキノリン(化合物番号1-7番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.34 (6H, s), 2.87 (2H, s), 7.16-7.29 (3H, m), 7.42-7.54 (3H, m), 7.68 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.42 (1H, s), 9.14 (1H, d, $J=1.4\text{Hz}$).
MS m/z : 304(M^+), 303, 289, 248, 144, 115.

【0115】

実施例 8

3- (3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) -6-クロロキノリン (化合物番号 1-11 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.87 (2H, s), 7.17 (1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 7.25 (1H, t, $J=7.7\text{Hz}$), 7.28 (1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 7.43 (1H, t, $J=7.7\text{Hz}$), 7.69 (1H, dd, $J=1.9, 8.8\text{Hz}$), 7.85 (1H, d, $J=1.9\text{Hz}$), 8.10 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 8.28 (1H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 9.10 (1H, d, $J=1.7\text{Hz}$).

MS m/z : 320(M^+), 319, 305, 264, 229, 152, 116.

【0116】

実施例 9

3- (3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) -8-メチルキノリン (化合物番号 1-19 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.85 (3H, s), 2.87 (2H, s), 7.21-7.28 (3H, m), 7.40-7.43 (1H, m), 7.47 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.60 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.72 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.11 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 300(M^+), 299, 285, 244, 149, 115.

【0117】

実施例 10

3- (3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) -8-メトキシキノリン (化合物番号 1-25 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.87 (2H, s), 4.12 (3H, s), 7.10 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.17 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.21 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.27 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.41 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.46 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=1.4\text{Hz}$), 9.06 (1H, d, $J=1.4\text{Hz}$).

MS m/z : 316(M^+), 315, 301, 286, 260, 230, 149, 128, 115.

【0118】

実施例 11

3- (3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) -8-ヒドロキシキノリン (化合物番号 1-31 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (6H, s), 2.86 (2H, s), 5.33 (1H, s), 7.18-7.47 (7H, m), 8.35 (1H, s), 8.98 (1H, s).

MS m/z : 303, 302(M^+), 288, 245, 164, 149, 129, 115.

【0119】

実施例 12

3- (5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) -4-クロロキノリン (化合物番号 1-35 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.91 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 2.98 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 6.71 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.11-7.17 (2H, m), 7.70 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.82 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 8.18 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.30 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.81 (1H, s).

MS m/z : 338(M^+), 323, 303, 287, 247.

【0120】

実施例 13

3- (5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)

-4-メトキシキノリン (化合物番号 1-37 番)

物性: アモルファス。

 $^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.40 (6H, brs), 2.42 (2H, brs), 3.90 (3H, s), 6.82-6.86 (1H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.57 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.75 (1H, d, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 8.11 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.23 (1H, dd, $J=1.4, 8.2\text{Hz}$), 8.70 (1H, s).MS m/z : 334(M^+), 319, 303, 288, 277, 263.

【0121】

実施例 14

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)-8-メチルキノリン (化合物番号 1-38 番)

物性: 油状物。

 $^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35 (6H, s), 2.85 (3H, s), 2.89 (2Hs), 7.05 (1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.18-7.22 (2H, m), 7.47 (1H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 7.61 (1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.73 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 8.34 (1H, s), 9.09 (1H, s).MS m/z : 318(M^+), 317, 303, 262, 152, 134, 115.

【0122】

実施例 15

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)-8-メトキシキノリン (化合物番号 1-39 番)

物性: 油状物。

 $^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.36 (6H, s), 2.89 (2H, s), 4.12 (3H, s), 7.00 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.12 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.18-7.27 (2H, m), 7.46 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.51 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 8.37 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.04 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).MS m/z : 334(M^+), 333, 319, 278, 248, 167.

【0123】

実施例 16

3-(6-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-41 番)

物性: 油状物。

 $^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.85 (2H, s), 6.91 (1H, td, $J=2.1, 8.9\text{Hz}$), 6.98 (1H, dd, $J=2.1, 8.9\text{Hz}$), 7.21 (1H, dd, $J=5.5, 8.2\text{Hz}$), 7.58 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.76 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.09 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).MS m/z : 304(M^+), 303, 289, 279, 248, 156.

【0124】

実施例 17

3-(7-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-42 番)

物性: 油状物。

 $^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.83 (2H, s), 6.93 (1H, dd, $J=2.7, 8.9\text{Hz}$), 7.13 (1H, td, $J=2.7, 8.2\text{Hz}$), 7.25 (1H, dd, $J=5.5, 8.2\text{Hz}$), 7.60 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.78 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 8.30 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.11 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).MS m/z : 304(M^+), 303, 289, 248, 156.

【0125】

実施例 18

3-(5-クロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-44 番)

融点: 85~88℃。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm : 1.36 (6H, s), 2.97 (2H, s), 7.11-7.22 (2H, m), 7.49 (1H, dd, $J=1.3$, 7.6Hz), 7.58 (1H, ddd, $J=1.3$, 6.9, 8.2Hz), 7.76 (1H, ddd, $J=1.3$, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=7.9$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.34 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 9.06 (1H, d, $J=2.0$ Hz).

MS m/z : 320(M^+), 319, 305, 285, 264.

【0126】

実施例 19

3-(5-クロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)-4-メチルキノリン (化合物番号 1-49 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm : 1.41 (6H, s), 2.54 (3H, s), 3.03 (2H, s), 6.78 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.09 (1H, t, $J=7.6$ Hz), 7.45 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.61 (1H, t, $J=8.2$ Hz), 7.75 (1H, t, $J=8.2$ Hz), 8.06 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.14 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.71 (1H, s).

MS m/z : 334(M^+), 333, 319, 194, 149, 115.

【0127】

実施例 20

3-(6-クロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-53 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm : 1.33 (6H, s), 2.84 (2H, s), 7.13-7.27 (3H, m), 7.59 (1H, t, $J=7.9$ Hz), 7.77 (1H, ddd, $J=1.3$, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=7.9$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.34 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 9.08 (1H, d, $J=2.0$ Hz).

MS m/z : 320(M^+), 319, 305, 285, 264.

【0128】

実施例 21

3-(7-クロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-54 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm : 1.33 (6H, s), 2.82 (2H, s), 7.16-7.26 (2H, m), 7.34 (1H, dd, $J=2.3$, 8.2Hz), 7.60 (1H, t, $J=7.9$ Hz), 7.77 (1H, ddd, $J=1.3$, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=7.9$ Hz), 8.17 (1H, d, $J=8.6$ Hz), 8.36 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 9.09 (1H, d, $J=2.0$ Hz).

MS m/z : 320(M^+), 319, 305, 285, 264.

【0129】

実施例 22

3-(5-ブロモ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-56 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm : 1.33 (6H, s), 2.84 (2H, s), 7.09 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 7.39 (1H, dd, $J=1.6$, 8.2Hz), 7.44 (1H, d, $J=1.6$ Hz), 7.59 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.6, 8.2Hz), 7.77 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.6, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 9.08 (1H, d, $J=2.2$ Hz).

MS m/z : 365(M^+), 349, 309, 285, 269.

【0130】

実施例 23

3-(6-ブロモ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-65 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm : 1.33 (6H, s), 2.84 (2H, s), 7.09 (1H, d, $J=8.2$ Hz),

出証特 2005-3015070

7.39 (1H, dd, $J=1.6$, 8.2Hz), 7.44 (1H, d, $J=1.6$ Hz), 7.59 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.6, 8.2Hz), 7.77 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.6, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 9.08 (1H, d, $J=2.2$ Hz).
MS m/z : 365(M^+), 349, 309, 285, 269.

【0131】

実施例 24

3-(7-ブromo-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-66 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.81 (2H, s), 7.17 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.34 (1H, d, $J=1.6$ Hz), 7.55 (1H, dd, $J=1.6$, 7.7Hz), 7.61 (1H, ddd, $J=1.1$, 7.1, 8.2Hz), 7.78 (1H, ddd, $J=1.6$, 7.1, 8.2Hz), 7.90 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.18 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.36 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 9.09 (1H, d, $J=2.2$ Hz).
MS m/z : 365(M^+), 349, 309, 285, 229.

【0132】

実施例 25

3-(5-ヨード-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-68 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.35 (6H, s), 2.92 (2H, s), 6.99 (1H, t, $J=8.2$ Hz), 7.19 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 7.59 (1H, t, $J=8.2$ Hz), 7.77 (1H, ddd, $J=1.4$, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 7.92 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.34 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 9.06 (1H, d, $J=2.1$ Hz).
MS m/z : 412(M^+), 397, 355, 285, 243, 229.

【0133】

実施例 26

3-(3, 3, 5-トリメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-69 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.34 (6H, s), 2.37 (3H, s), 2.81 (2H, s), 7.04 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.13 (1H, t, $J=7.6$ Hz), 7.30 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.58 (1H, ddd, $J=1.4$, 6.9, 7.6Hz), 7.75 (1H, ddd, $J=1.4$, 6.9, 8.2Hz), 7.86 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 8.15 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 9.07 (1H, d, $J=2.1$ Hz).
MS m/z : 300(M^+), 299, 285, 269, 258, 244.

【0134】

実施例 27

3-(3, 3, 6-トリメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-70 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.39 (3H, s), 2.82 (2H, s), 7.04-7.09 (3H, d, m), 7.57 (1H, t, $J=8.2$ Hz), 7.75 (1H, ddd, $J=1.4$, 6.9, 8.2Hz), 7.86 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.36 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 9.10 (1H, d, $J=2.1$ Hz).
MS m/z : 300(M^+), 299, 285, 269, 258, 244.

【0135】

実施例 28

3-(3, 3, 7-トリメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-71 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (6H, s), 2.26 (3H, s), 2.82 (2H, s), 6.99 (1H

, s), 7.14-7.24 (2H, m), 7.58 (1H, ddd, J=1.3, 6.9, 8.2Hz), 7.76 (1H, ddd, J=1.3, 6.9, 8.2Hz), 7.89 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.38 (1H, d, J=2.0Hz), 9.09 (1H, d, J=2.0Hz).

MS m/z : 300(M⁺), 299, 285, 269, 258, 244, 156.

【0136】

実施例 29

3-(5-ビニル-3,3-ジメチル-4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-81 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.34 (6H, s), 2.91 (2H, s), 5.45 (1H, d, J=11.0Hz), 5.72 (1H, t, J=17.2Hz), 7.02 (1H, dd, J=11.0, 17.2Hz), 7.13 (1H, d, J=7.6Hz), 7.23 (1H, t, J=7.6Hz), 7.58 (1H, t, J=8.2Hz), 7.62 (1H, d, J=7.6Hz), 7.76 (1H, t, J=8.2Hz), 7.87 (1H, d, J=7.6Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.36 (1H, d, J=2.1Hz), 9.08 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 312(M⁺), 311, 297, 285, 269, 256.

【0137】

実施例 30

3-(5-エチニル-3,3-ジメチル-4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-85 番)

物性: アモルファス。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.35 (6H, s), 3.06 (2H, s), 3.36 (1H, s), 7.21 (2H, d, J=4.4Hz), 7.58-7.62 (2H, m), 7.77 (1H, ddd, J=1.6, 7.1, 7.7Hz), 7.88 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.35 (1H, d, J=2.2Hz), 9.07 (1H, d, J=2.2Hz).

MS m/z : 310(M⁺), 295, 268, 254.

【0138】

実施例 31

3-(5-フェニル-3,3-ジメチル-4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-89 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.25 (6H, s), 2.81 (2H, s), 7.21-7.32 (2H, m), 7.36-7.51 (6H, m), 7.58 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 7.9Hz), 7.58 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.5Hz), 7.89 (1H, d, J=7.9Hz), 8.17 (1H, d, J=8.5Hz), 8.42 (1H, d, J=2.1Hz), 9.15 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 362(M⁺), 347, 306.

【0139】

実施例 32

3-[5-(2-チエニル)-3,3-ジメチル-4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-94 番)

物性: アモルファス。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.29 (6H, s), 2.96 (2H, s), 7.10 (1H, dd, J=1.1, 3.8Hz), 7.17 (1H, dd, J=3.8, 4.9Hz), 7.22 (1H, dd, J=1.1, 7.7Hz), 7.26-7.29 (1H, m), 7.43 (1H, dd, J=1.1, 4.9Hz), 7.57-7.61 (2H, m), 7.77 (1H, ddd, J=1.6, 7.1, 8.2Hz), 7.89 (1H, d, J=7.6Hz), 8.17 (1H, d, J=8.2Hz), 8.40 (1H, d, J=2.2Hz), 9.13 (1H, d, J=2.2Hz).

MS m/z : 368(M⁺), 353, 326, 312, 299, 285, 271.

【0140】

実施例 33

3-[5-(3-チエニル)-3,3-ジメチル-4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-95 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.28 (6H, s), 2.88 (2H, s), 7.19-7.21 (2H, m), 7.26-7.27 (1H, m), 7.30 (1H, dd, $J=1.1, 2.7\text{Hz}$), 7.46 (1H, dd, $J=2.7, 4.9\text{Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=1.1, 7.7\text{Hz}$), 7.60 (1H, ddd, $J=1.1, 7.1, 8.2\text{Hz}$), 7.77 (1H, ddd, $J=1.1, 7.1, 8.2\text{Hz}$), 7.86 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.41 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 9.13 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$).

MS m/z : 368(M^+), 353, 326, 312, 285, 271.

【0141】

実施例 34

3-[5-(5-オキサゾリル)-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-97 番)

融点: 175~179°C.

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 3.00 (2H, s), 7.26-7.31 (2H, m), 7.35 (1H, t, $J=7.7\text{Hz}$), 7.60 (1H, ddd, $J=1.1, 7.1, 8.2\text{Hz}$), 7.76-7.80 (2H, m), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.05 (1H, s), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.38 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 9.10 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$).

MS m/z : 353(M^+), 338, 311, 297, 269.

【0142】

実施例 35

1-(3,3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3,4-ジヒドロイソキノリン-5-イル)エタノン=オキシム (化合物番号 1-98 番)

融点: 187~190°C.

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (6H, s), 2.29 (3H, s), 2.89 (2H, s), 7.21 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.25 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.41 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.77 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.19 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.11 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.39 (1H, brs).

MS m/z : 343(M^+), 326, 310, 296, 285, 269.

【0143】

実施例 36

1-(3,3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3,4-ジヒドロイソキノリン-5-イル)エタノン=O-メチルオキシム (化合物番号 1-100 番) 実施例 37 の化合物の立体異性体

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (6H, s), 2.24 (3H, s), 2.89 (2H, s), 4.03 (3H, s), 7.21 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.25-7.28 (1H, m), 7.42 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.76 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.08 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 357(M^+), 342, 326, 310, 285, 269.

【0144】

実施例 37

1-(3,3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3,4-ジヒドロイソキノリン-5-イル)エタノン=O-メチルオキシム (化合物番号 1-100 番) 実施例 36 の化合物の立体異性体

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (6H, s), 2.20 (3H, s), 2.69 (2H, brs), 3.85 (3H, s), 7.21 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.22 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.29 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.77 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.12 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 357(M^+), 342, 326, 310, 285, 269.

【0145】

実施例 38

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-エチルオキシム (化合物番号 1-101 番) 実施例 39 の化合物の立体異性体

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (6H, s), 1.37 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.26 (3H, s), 2.90 (2H, s), 4.27 (2H, q, $J=6.9\text{Hz}$), 7.20 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.26 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.43 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.76 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.08 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 371(M^+), 356, 326, 310, 285, 269.

【0146】

実施例 39

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-エチルオキシム (化合物番号 1-101 番) 実施例 38 の化合物の立体異性体

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.23 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.32 (6H, s), 2.19 (3H, s), 2.69 (2H, brs), 4.10 (2H, q, $J=6.9\text{Hz}$), 7.19-7.23 (2H, m), 7.59 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.77 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.12 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 371(M^+), 356, 326, 310, 285, 269.

【0147】

実施例 40

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-*t*-ブチルオキシム (化合物番号 1-103 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.30 (6H, s), 1.37 (9H, s), 2.24 (3H, s), 2.95 (2H, s), 7.18 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.26 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.44 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.76 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.37 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.10 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 399(M^+), 384, 342, 326, 310, 285, 269.

【0148】

実施例 41

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-アリルオキシム (化合物番号 1-104 番) 実施例 42 の化合物の立体異性体

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (6H, s), 2.20 (3H, s), 2.70 (2H, brs), 4.55 (2H, d, $J=6.2\text{Hz}$), 5.19 (1H, ddd, $J=1.4, 2.7, 11.7\text{Hz}$), 5.23 (1H, ddd, $J=1.4, 2.7, 17.2\text{Hz}$), 5.94-5.99 (1H, m), 7.21-7.23 (2H, m), 7.28 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.77 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.11 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

【0149】

実施例 42

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-アリルオキシム (化合物番号 1-104 番) 実施例 41 の化合物の立体異性体

物性: 128~131°C。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (6H, s), 2.28 (3H, s), 2.90 (2H, s), 4.73 (2H, d, $J=5.5\text{Hz}$), 5.28 (1H, ddd, $J=1.4, 2.7, 10.3\text{Hz}$), 5.38 (1H, ddd, $J=1.4, 2.7, 17.2\text{Hz}$), 6.05-6.13 (1H, m), 7.21 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.24-7.28 (1H, m), 7.42 (1H, dd, $J=1.4, 7.6\text{Hz}$), 7.59 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.78 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.08 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 383(M^+), 368, 326, 310, 285, 269.

【0150】

実施例 4 3

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-ベンジルオキシム (化合物番号 1-105番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.21 (6H, s), 2.29 (3H, s), 2.72 (2H, s), 5.25 (2H, s), 7.18-7.45 (8H, m), 7.58 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.76 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.86 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.06 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 433(M^+), 418, 326, 310, 285, 269.

【0151】

実施例 4 4

1- (3, 3-ジメチル-1-キノリン-3-イル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-5-イル) エタノン=O-フェニルオキシム (化合物番号 1-106番) 立体異性体混合物 (1対2)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.28 (12H x 1/3, s), 1.33 (12H x 2/3, s), 2.35 (6H x 1/3, s), 2.48 (6H x 2/3, s), 2.74 (4H x 1/3, brs), 2.99 (4H x 2/3, s), 7.00-7.53 (16H, m), 7.58-7.62 (2H, m), 7.76-7.79 (2H, m), 7.88-7.89 (2H, m), 8.16-8.18 (2H, m), 8.39 (2H x 2/3, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.41 (2H x 1/3, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.11 (2H x 2/3, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.13 (2H x 1/3, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 419(M^+), 404, 326, 310, 269, 255.

【0152】

実施例 4 5

3- (6-メトキシ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-108番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (6H, s), 2.83 (2H, s), 3.86 (3H, s), 6.71 (1H, dd, $J=2.8, 8.2\text{Hz}$), 6.80 (1H, d, $J=2.8\text{Hz}$), 7.14 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.58 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.75 (1H, ddd, $J=1.4, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.09 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 316(M^+), 315, 301, 285, 260.

【0153】

実施例 4 6

3- (8-メトキシ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-110番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.30 (6H, s), 2.79 (2H, s), 3.40 (3H, s), 6.82 (1H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 6.89 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.39 (1H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 7.53 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.69 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.80 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.10 (1H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 8.83 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.85 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 316(M^+), 315, 301, 285, 260.

【0154】

実施例 47

3-(5-アミノ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-111 番)

融点: 181~184°C.

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.37 (6H, s), 2.63 (2H, s), 3.76 (2H, brs), 6.65 (1H, dd, $J=1.1$, 7.7Hz), 6.84 (1H, dd, $J=1.1$, 7.7Hz), 7.05 (1H, t, $J=7.7$ Hz), 7.57 (1H, ddd, $J=1.3$, 6.9, 8.2Hz), 7.74 (1H, ddd, $J=1.3$, 6.9, 8.5Hz), 7.86 (1H, dd, $J=1.3$, 8.2Hz), 8.15 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.34 (1H, d, $J=2.3$ Hz), 9.07 (1H, d, $J=2.3$ Hz).

MS m/z : 401(M^+), 286, 270, 259, 245.

【0155】

実施例 48

3-(5-アセチルアミノ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-112 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (6H, s), 2.27 (3H, s), 2.72 (2H, s), 7.08 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.20-7.26 (1H, m), 7.43 (1H, brs), 7.58 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.9, 7.9Hz), 7.71-7.79 (2H, m), 7.86 (1H, d, $J=7.9$ Hz), 8.15 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 9.08 (1H, d, $J=2.1$ Hz).

MS m/z : 343(M^+), 328, 300, 285, 269, 245.

【0156】

実施例 49

3-(5-ホルミル-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.36 (6H, s), 3.37 (2H, s), 7.43 (1H, t, $J=7.7$ Hz), 7.49 (1H, dd, $J=1.1$, 7.7Hz), 7.60 (1H, ddd, $J=1.1$, 7.1, 8.2Hz), 7.78 (1H, ddd, $J=1.1$, 7.1, 8.2Hz), 7.88 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 7.97 (1H, dd, $J=1.1$, 7.7Hz), 8.17 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 9.07 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 10.4 (1H, s).

MS m/z : 314(M^+), 299, 285, 269, 258, 244.

【0157】

実施例 50

3-(5-メチルアミノカルボニル-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-115 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.31 (3H, brs), 1.43 (3H, s), 2.19 (3H, s), 2.75 (2H, brs), 7.22 (1H, dd, $J=1.6$, 7.7Hz), 7.25 (1H, dd, $J=1.6$, 7.7Hz), 7.30 (1H, t, $J=7.7$ Hz), 7.59 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.6, 7.7Hz), 7.77 (1H, ddd, $J=1.1$, 6.6, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 8.19 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 8.41 (1H, d, $J=2.2$ Hz), 8.94 (1H, brs), 9.12 (1H, d, $J=2.2$ Hz).

MS m/z : 343(M^+), 326, 310, 285, 269.

【0158】

実施例 51

3-(5-シアノ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン (化合物番号 1-116 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.37 (6H, s), 3.10 (2H, s), 7.37 (1H, t, $J=7.9$ Hz), 7.48 (1H, dd, $J=0.8$, 7.9Hz), 7.61 (1H, ddd, $J=1.2$, 6.9, 8.2Hz), 7.73-7.82 (2H, m), 7.88 (1H, d, $J=7.9$ Hz), 8.17 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 9.06 (1H, d, $J=2.1$ Hz).

MS m/z : 311(M⁺), 310, 296, 269, 255

【0159】

実施例 52

3-(5, 6-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-117 番)

物性: ガム状。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.36 (6H, s), 2.91 (2H, s), 7.01-7.08 (2H, m), 7.57-7.62 (1H, m), 7.74-7.80 (1H, m), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.5Hz), 8.33 (1H, d, J=2.1Hz), 9.06 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 322(M⁺), 321, 307, 266.

【0160】

実施例 53

3-(5, 6-ジクロロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-126 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.36 (6H, s), 3.02 (2H, s), 7.10 (1H, d, J=8.2Hz), 7.37 (1H, d, J=8.2Hz), 7.60 (1H, t, J=8.2Hz), 7.78 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.33 (1H, d, J=2.1Hz), 9.05 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 355(M⁺), 354, 353, 319, 298, 263.

【0161】

実施例 54

3-(6-フルオロ-3, 3, 7-トリメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-136 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.32 (6H, s), 2.18 (3H, s), 2.81 (2H, s), 6.93 (1H, d, J=9.5Hz), 7.02 (1H, d, J=7.4Hz), 7.59 (1H, ddd, J=1.1, 6.9, 8.2Hz), 7.77 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 7.89 (1H, dd, J=1.1, 8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.36 (1H, d, J=2.1Hz), 9.06 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 318(M⁺), 317, 303, 262.

【0162】

実施例 55

3-(3-エチル-3-メチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-137 番)

物性: ガム状。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.01 (3H, t, J=7.4Hz), 1.25 (3H, s), 1.63 (1H, qd, J=13.0Hz, 7.4Hz), 1.73 (1H, qd, J=13.0Hz, 7.4Hz), 2.78 (1H, d, J=15.8Hz), 2.90 (1H, d, J=15.8Hz), 7.19-7.28 (3H, m), 7.38-7.43 (1H, m), 7.58 (1H, dd, J=7.9Hz, 7.1Hz), 7.76 (1H, dd, J=8.5Hz, 7.1Hz), 7.87 (1H, d, J=7.9Hz), 8.16 (1H, d, J=8.5Hz), 8.37 (1H, d, J=2.1Hz), 9.12 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 300(M⁺), 285, 271, 255, 245, 230, 202, 128.

【0163】

実施例 56

3-(3-エチル-5-フルオロ-3-メチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-147 番)

物性: ガム状。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.03 (3H, t, J=7.4Hz), 1.26 (3H, s), 1.65 (1H, qd, J=14.0Hz, 7.4Hz), 1.74 (1H, qd, J=14.0Hz, 7.4Hz), 2.82 (1H, d, J=16.4Hz), 2.88 (1H, d, J=16.4Hz), 7.04 (1H, dd, J=6.6Hz, 2.1Hz), 7.14-7.23 (2H, m), 7.61 (1H, d, dd, J=8.2Hz, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.77 (1H, ddd, J=8.2Hz, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.87 (1H, d,

J=8.2Hz), 8.15 (1H, d, J=8.2Hz), 8.35 (1H, d, J=2.1Hz), 9.10 (1H, d, J=2.1Hz).
MS m/z : 318(M⁺), 303, 289, 263, 248, 220, 134.

【0164】

実施例 57

3-(3-メチル-3-プロピル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-175 番)

物性: ガム状。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm 0.92 (3H, t, J=7.5Hz), 1.26 (3H, s), 1.43-1.70 (4H, m), 2.78 (1H, d, J=15.8Hz), 2.92 (1H, d, J=15.8Hz), 7.19-7.27 (3H, m), 7.37-7.44 (1H, m), 7.58 (1H, ddd, J=8.2Hz, 7.1Hz, 1.3Hz), 7.76 (1H, ddd, J=8.2Hz, 7.1Hz, 1.3Hz), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.36 (1H, d, J=2.1Hz), 9.11 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 314(M⁺), 313, 299, 285, 271, 255, 230, 202, 128.

【0165】

実施例 58

3-(5-フルオロ-3-メチル-3-プロピル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-185 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 0.93 (3H, t, J=6.3Hz), 1.28 (3H, s), 1.46-1.72 (4H, m), 2.82 (1H, d, J=16.4Hz), 2.89 (1H, d, J=16.4Hz), 7.03 (1H, dd, J=6.5Hz, 2.1Hz), 7.14-7.22 (2H, m), 7.59 (1H, ddd, J=8.2Hz, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.77 (1H, ddd, J=8.2Hz, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.2Hz, 1.3Hz), 8.15 (1H, d, J=8.2Hz), 8.35 (1H, d, J=2.1Hz), 9.10 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 331(M-1), 315, 303, 289, 275, 263, 248, 149.

【0166】

実施例 59

3-(3-イソプロピル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-213 番)

物性: ガム状。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 0.98 (3H, d, J=6.8Hz), 1.11 (3H, d, J=6.8Hz), 1.13 (3H, s), 1.94 (1H, hept, J=6.8Hz), 2.74 (1H, d, J=15.8Hz), 2.95 (1H, d, J=15.8Hz), 7.21-7.28 (3H, m), 7.37-7.44 (1H, m), 7.58 (1H, t, J=8.2Hz), 7.76 (1H, t, J=8.2Hz), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.36 (1H, d, J=2.1Hz), 9.15 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 314(M⁺), 299, 271, 255, 230.

【0167】

実施例 60

3-(3-イソブチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-251 番)

物性: ガム状。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 0.93 (3H, d, J=6.6Hz), 1.01 (3H, d, J=6.6Hz), 1.34 (3H, s), 1.40-1.62 (2H, m), 1.96 (1H, bhept, J=6.6Hz), 2.81 (1H, d, J=15.8Hz), 2.89 (1H, d, J=15.8Hz), 7.22-7.27 (3H, m), 7.37-7.44 (1H, m), 7.57 (1H, ddd, J=8.2Hz, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.75 (1H, ddd, J=8.2Hz, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.86 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.36 (1H, d, J=2.1Hz), 9.15 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 328(M⁺), 313, 285, 271, 257, 245, 230, 128.

【0168】

実施例 61

3-(3-tert-ブチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-289 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.97 (3H, s), 1.10 (9H, s), 2.67 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 3.14 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 7.20-7.30 (3H, m), 7.37-7.42 (1H, m), 7.58 (1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.36 (1H, s), 9.23 (1H, s).

MS m/z : 328(M^+), 313, 271, 255, 230, 142, 128, 115.

【0169】

実施例 62

3-(3-イソペンチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-307 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.86 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 0.89 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.25 (3H, s), 1.25-1.75 (5H, m), 2.79 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 2.88 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 7.21-7.27 (3H, m), 7.37-7.43 (1H, m), 7.58 (1H, ddd, $J=7.9\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.76 (1H, ddd, $J=8.5\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.87 (1H, d, $J=7.9\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.12 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 342(M^+), 341, 327, 285, 271, 257, 245, 230, 202, 128.

【0170】

実施例 63

3-(3,3-ジエチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-345 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.96 (6H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.53-1.74 (4H, m), 2.82 (2H, s), 7.20-7.25 (3H, m), 7.35-7.41 (1H, m), 7.56 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.73 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.85 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 9.16 (1H, s).

MS m/z : 314(M^+), 285, 255, 230, 128, 116.

【0171】

実施例 64

3-(3-エチル-3-イソブチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-383 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.90 (3H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 0.98 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.00 (3H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 1.44 (1H, dd, $J=14.0\text{Hz}$, 6.0Hz), 1.53 (1H, dd, $J=14.0\text{Hz}$, 6.0Hz), 1.64-1.97 (3H, m), 2.82 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 2.85 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 7.22-7.26 (3H, m), 7.37-7.44 (1H, m), 7.58 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 7.1Hz), 7.76 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 7.1Hz), 7.86 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 9.16 (1H, s).

MS m/z : 342(M^+), 341, 327, 313, 299, 285, 271, 257, 245, 230, 202, 128.

【0172】

実施例 65

3-(3,3-ジプロピル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-384 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.26 (6H, d, $J=7.1\text{Hz}$), 1.31-1.67 (8H, m), 2.83 (2H, s), 7.20-7.26 (3H, m), 7.36-7.43 (1H, m), 7.58 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.76 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.34 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.12 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 342(M^+), 341, 313, 299, 285, 271, 257, 230, 149, 128.

【0173】

実施例 66

3-(3-クロロメチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-385 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.33 (3H, s), 2.91 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 3.14 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 3.65 (1H, d, $J=10.8\text{Hz}$), 3.76 (1H, d, $J=10.8\text{Hz}$), 7.23-7.34 (3H, m), 7.43-7.49 (1H, m), 7.60 (1H, ddd, $J=8.5\text{Hz}$, 7.1Hz, 1.3Hz), 7.78 (1H, ddd, $J=8.5\text{Hz}$, 7.1Hz, 1.3Hz), 7.88 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.38 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.11 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 340(M^+), 311, 269, 255, 242, 230, 149.

【0174】

実施例 67

3-(3-ジクロロメチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-386 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.37 (3H, s), 3.02 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 3.41 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 6.01 (1H, s), 7.28-7.37 (3H, m), 7.44-7.51 (1H, m), 7.60 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz), 7.78 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz), 7.89 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.14 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 354(M^+), 319, 283, 271, 255, 149.

【0175】

実施例 68

3-(3-トリフルオロメチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-387 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.63 (3H, s), 3.78 (1H, d, $J=16.9\text{Hz}$), 4.50 (1H, d, $J=16.9\text{Hz}$), 7.33-7.44 (2H, m), 7.55-7.65 (3H, m), 7.79 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 7.1Hz, 1.3Hz), 7.87 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.18 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.35 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.12 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 340(M^+), 311, 269, 255, 242, 230, 149.

【0176】

実施例 69

3-(3-トリフルオロエチル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-424 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.44 (3H, s), 2.41 (1H, qd, $J=15.1\text{Hz}$, 11.6Hz), 2.60 (1H, qd, $J=15.1\text{Hz}$, 11.6Hz), 2.98 (1H, d, $J=15.0\text{Hz}$), 3.06 (1H, d, $J=15.0\text{Hz}$), 7.24-7.32 (3H, m), 7.43-7.49 (1H, m), 7.59 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz), 7.78 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.38 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 9.13 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$).

MS m/z : 354(M^+), 340, 286, 272, 256, 231, 136.

【0177】

実施例 70

3-[3,3-ジ(クロロメチル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-212 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.15 (2H, s), 3.68 (2H, d, $J=11.1\text{Hz}$), 3.87 (2H, d, $J=11.1\text{Hz}$), 7.30-7.38 (3H, m), 7.45-7.53 (1H, m), 7.61 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.79 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.90 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 1.3Hz), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.41 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.14 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

出証特 2005-3015070

MS m/z : 354(M^+), 319, 305, 283, 269, 255, 229.

【0178】

実施例 71

3-(3-メチル-3-フェニル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-464 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.60 (3H, s), 3.18 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 3.30 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 7.17-7.44 (7H, m), 7.57-7.63 (3H, m), 7.78 (1H, ddd, $J=1.3, 6.9, 8.2\text{Hz}$), 7.90 (1H, dd, $J=1.1, 7.9\text{Hz}$), 8.18 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.47 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.26 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 348(M^+), 333, 271, 245, 230.

【0179】

実施例 72

3-[3-(4-フルオロフェニル)-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-502 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.57 (3H, s), 3.17 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 3.24 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 6.99 (2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 7.21-7.45 (4H, m), 7.56-7.63 (3H, m), 7.78 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}, 6.9\text{Hz}, 1.0\text{Hz}$), 7.90 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.19 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.46 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.25 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 367($M+1$), 352, 272, 246, 231, 184.

【0180】

実施例 73

3-[3-(4-クロロフェニル)-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-540 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.56 (3H, s), 3.15 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 3.25 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 7.26-7.45 (6H, m), 7.56 (2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.60 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}, 6.9\text{Hz}, 1.0\text{Hz}$), 7.78 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}, 6.9\text{Hz}, 1.0\text{Hz}$), 7.90 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.19 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.46 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.25 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 383($M+1$), 368, 272, 246, 231, 150.

【0181】

実施例 74

3-(3-トリフルオロメチル-3-フェニル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-578 番)

物性: アモルファス。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.57 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 3.64 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 7.18-7.30 (5H, m), 7.34-7.42 (2H, m), 7.56 (2H, d, $J=7.1\text{Hz}$), 7.63 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}, 6.9\text{Hz}, 1.3\text{Hz}$), 7.79 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}, 6.9\text{Hz}, 1.3\text{Hz}$), 7.94 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.19 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.54 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.29 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 402(M^+), 361, 333, 325, 255, 230, 166, 128.

【0182】

実施例 75

3-[3-クロロメチル-3-(4-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-594 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.46 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 3.52 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 3.94 (2H, s), 6.98 (2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 7.21-7.26 (2H, m), 7.36-7.47 (2H, m), 7.52-7.65 (3H, m), 7.80 (1H, ddd, $J=8.5\text{Hz}, 7.1\text{Hz}, 1.3\text{Hz}$), 7.91 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.18 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.44 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 9.24 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$).

MS m/z : 400(M^+), 365, 351, 245, 230, 175, 128.

【0183】

実施例 76

3-[3-クロロメチル-3-(4-クロロフェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-632 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 3.46 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 3.51 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 3.93 (2H, s), 7.22-7.28 (4H, m), 7.36-7.53 (4H, m), 7.62 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.80 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.91 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.18 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.44 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.24 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 416(M^+), 381, 367, 255, 245, 230, 165, 128.

【0184】

実施例 77

3-[3-メチル-3-(3-ピリジル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-670 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.61 (3H, s), 3.23 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 3.28 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 7.22-7.47 (5H, m), 7.61 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.79 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.90 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 1.3Hz), 7.99 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 1.3Hz), 8.19 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.45 (1H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 8.47 (1H, dd, $J=2.4\text{Hz}$, 1.6Hz), 8.85 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.25 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 349(M^+), 334, 305, 271, 245, 230, 195.

【0185】

実施例 78

3-[3-メチル-3-(4-ピリジル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル]キノリン (化合物番号 1-671 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (500MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55 (3H, s), 3.03 (1H, d, $J=13.8\text{Hz}$), 3.18 (1H, d, $J=13.8\text{Hz}$), 7.27-7.46 (4H, m), 7.55 (2H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.61 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.79 (1H, ddd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz, 1.3Hz), 7.91 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.19 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.46 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.55 (2H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 9.26 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 349(M^+), 334, 271, 245, 230, 175.

【0186】

実施例 79

3-(3-ベンジル-3-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-672 番)

物性: ガム状。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.32 (3H, s), 2.74 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 2.84 (1H, d, $J=13.0\text{Hz}$), 2.87 (1H, d, $J=15.8\text{Hz}$), 2.93 (1H, d, $J=13.0\text{Hz}$), 7.18-7.31 (8H, m), 7.41-7.47 (1H, m), 7.59 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz), 7.77 (1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$, 6.9Hz), 7.88 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.16 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

MS m/z : 362(M^+), 361, 341, 313, 299, 271, 255, 230.

【0187】

実施例 80

1'-キノリン-3-イル-4'-H-スビロ[シクロペンタン-1,3'-イソキノリン] (化合物番号 1-710 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55-1.96 (8H, m), 2.91 (2H, s), 7.19-7.26 (3H, m)

, 7.29-7.38 (1H, m), 7.58 (1H, t, J=8.5Hz), 7.76 (1H, t, J=8.5Hz), 7.87 (1H, d, J=8.5Hz), 8.15 (1H, d, J=8.5Hz), 8.37 (1H, d, J=2.3Hz), 9.13 (1H, d, J=2.3Hz).
MS m/z : 312(M⁺), 311, 283, 270, 230, 149, 128, 115.

【0188】

実施例 81

5'-フルオロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロペンタン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-720 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.74-1.98 (8H, m), 2.93 (2H, s), 7.04 (1H, d, J=7.6Hz), 7.17-7.23 (2H, m), 7.59 (1H, t, J=8.2Hz), 7.77 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.35 (1H, d, J=2.1Hz), 9.12 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 330(M⁺), 301, 288, 273, 248, 149.

【0189】

実施例 82

6'-フルオロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロペンタン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-721 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.70-1.99 (8H, m), 2.89 (2H, s), 6.91 (1H, td, J=2.6, 8.6Hz), 6.99 (1H, dd, J=2.3, 8.6Hz), 7.21 (1H, dd, J=5.6, 8.6Hz), 7.58 (1H, t, J=7.9Hz), 7.75 (1H, t, J=8.2Hz), 7.86 (1H, d, J=7.9Hz), 8.15 (1H, d, J=8.2Hz), 8.34 (1H, d, J=2.0Hz), 9.11 (1H, d, J=2.0Hz).

MS m/z : 330(M⁺), 301, 288, 273, 248, 149.

【0190】

実施例 83

7'-フルオロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロペンタン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-722 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.70-1.98 (8H, m), 2.87 (2H, s), 6.94 (1H, dd, J=2.7, 8.9Hz), 7.12 (1H, td, J=2.7, 8.2Hz), 7.24-7.26 (1H, m), 7.60 (1H, t, J=8.2Hz), 7.78 (1H, t, J=8.2Hz), 7.89 (1H, d, J=8.2Hz), 8.17 (1H, d, J=8.2Hz), 8.35 (1H, d, J=2.1Hz), 9.13 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 330(M⁺), 301, 288, 273, 248.

【0191】

実施例 84

6'-フルオロ-1'-(4-メチルキノリン)-3-イル-4'-H-スピロ[シクロペンタン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-723 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.77-1.96 (8H, m), 2.56 (3H, s), 2.96 (2H, s), 6.69-6.85 (2H, m), 6.98 (1H, dd, J=2.1, 8.9Hz), 7.61 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 7.6Hz), 7.75 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 8.07 (1H, d, J=7.6Hz), 8.14 (1H, d, J=8.2Hz), 8.73 (1H, s).

MS m/z : 344(M⁺), 343, 329, 170, 156, 128.

【0192】

実施例 85

5'-クロロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロペンタン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-724 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.69-2.00 (8H, m), 3.02 (2H, s), 7.12-7.22 (2H, m), 7.48 (1H, dd, J=1.3, 7.7Hz), 7.59 (1H, ddd, J=1.3, 6.9, 7.9Hz), 7.77 (1H, ddd, J=1.3, 6.9, 7.9Hz), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 9.12 (1H, d, J=2.1Hz).

出証特 2005-3015070

=1.3, 6.9, 8.2Hz), 7.87 (1H, d, J=7.9Hz), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.34 (1H, d, J=2.1Hz), 9.09 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 346(M⁺), 311, 304, 279, 264, 231.

【0193】

実施例 86

1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-749 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.51-1.54 (6H, m), 1.74-1.81 (4H, m), 2.85 (2H, s), 7.23-7.28 (3H, m), 7.37-7.42 (1H, m), 7.56 (1H, t, J=8.0Hz), 7.75 (1H, t, J=8.0Hz), 7.86 (1H, d, J=8.0Hz), 8.15 (1H, d, J=8.0Hz), 8.36 (1H, d, J=2.0Hz), 9.18 (1H, d, J=2.0Hz).

MS m/z : 326(M⁺), 283, 230, 128, 115.

【0194】

実施例 87

1'-(4-メチルキノリン)-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-755 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.54-1.80 (10H, m), 2.61 (3H, s), 2.95 (2H, s), 6.84 (1H, d, J=7.6Hz), 7.10-7.36 (3H, m), 7.60 (1H, t, J=8.0Hz), 7.73 (1H, t, J=8.0Hz), 8.06 (1H, d, J=8.0Hz), 8.14 (1H, d, J=8.0Hz), 8.77 (1H, s).

MS m/z : 340(M⁺), 339, 325, 311, 297, 285, 257, 244.

【0195】

実施例 88

5'-フルオロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-759 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.55-1.83 (10H, m), 2.88 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=6.6Hz), 7.19-7.27 (2H, m), 7.60 (1H, t, J=8.0Hz), 7.78 (1H, t, J=8.0Hz), 7.88 (1H, d, J=8.0Hz), 8.17 (1H, d, J=8.0Hz), 8.36 (1H, d, J=2.0Hz), 9.16 (1H, d, J=2.0Hz).

MS m/z : 344(M⁺), 301, 288, 275, 263, 248, 220.

【0196】

実施例 89

6'-フルオロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-760 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.51-1.85 (10H, m), 2.84 (2H, s), 6.88-7.00 (2H, m), 7.21-7.26 (1H, m), 7.59 (1H, t, J=8.4Hz), 7.76 (1H, t, J=8.4Hz), 7.87 (1H, d, J=8.4Hz), 8.16 (1H, d, J=8.4Hz), 8.35 (1H, s), 9.14 (1H, s).

MS m/z : 344(M⁺), 315, 301, 288, 248, 220.

【0197】

実施例 90

7'-フルオロ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-761 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.55-1.81 (10H, m), 2.81 (2H, s), 6.95-7.26 (3H, m), 7.60 (1H, t, J=8.0Hz), 7.77 (1H, t, J=8.0Hz), 7.88 (1H, d, J=8.0Hz), 8.17 (1H, d, J=8.0Hz), 8.36 (1H, s), 9.17 (1H, s).

MS m/z : 344(M⁺), 315, 301, 288, 275, 262, 248, 220, 156, 128.

【0198】

実施例 9 1

6'-フルオロ-1'-(4-メチルキノリン)-3-イル-4' H-スビロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-762 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55-1.80 (10H, m), 2.55 (3H, s), 2.92 (2H, s), 6.80-6.84 (2H, m), 6.97 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.60 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.74 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 8.06 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.13 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.74 (1H, s).

MS m/z : 358(M^+), 357, 343, 315, 168, 140, 129, 114.

【0199】

実施例 9 2

6'-クロロ-1'-キノリン-3-イル-4' H-スビロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-764 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.47-1.85 (10H, m), 2.83 (2H, s), 7.16-7.27 (3H, m), 7.59 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.76 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.34 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.14 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).

MS m/z : 362($\text{M}^+ + 2$), 360(M^+), 317, 304, 264, 141, 128, 115.

【0200】

実施例 9 3

7'-クロロ-1'-キノリン-3-イル-4' H-スビロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-765 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55-1.87 (12H, m), 2.85 (2H, s), 7.20-7.26 (3H, m), 7.37-7.39 (1H, m), 7.58 (1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.14 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).

MS m/z : 362($\text{M}^+ + 2$), 360(M^+), 317, 304, 264, 229, 128, 115.

【0201】

実施例 9 4

6'-クロロ-1'-(4-メチルキノリン)-3-イル-4' H-スビロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-766 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55-1.81 (10H, m), 2.54 (3H, s), 2.91 (2H, s), 6.78 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.10-7.29 (2H, m), 7.61 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.74 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 8.07 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.14 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.74 (1H, s).

MS m/z : 376($\text{M}^+ + 2$), 374(M^+), 373, 357, 331, 170, 141, 115.

【0202】

実施例 9 5

6'-ブromo-1'-キノリン-3-イル-4' H-スビロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-764 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.50-1.84 (10H, m), 2.81 (2H, s), 7.11 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.38 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.42 (1H, s), 7.57 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.85 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.33 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.15 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).

MS m/z : 406($\text{M}^+ + 2$), 404(M^+), 375, 361, 349, 325, 268, 229, 141, 128, 115.

【0203】

実施例 9 6

5'-メチル-1'-キノリン-3-イル-4' H-スビロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-771 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.52-1.86 (10H, m), 2.39 (3H, s), 2.80 (2H, s), 7.06-7.16 (2H, m), 7.26-7.30 (1H, m), 7.57 (1H, t, $J=8.0\text{Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=8.0\text{Hz}$), 7.86 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.35 (1H, s), 9.14 (1H, s).
MS m/z : 340(M^+), 297, 284, 244, 149, 128, 115.

【0204】

実施例 97

7'-メチル-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-773 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.51-1.84 (10H, m), 2.27 (3H, s), 2.81 (2H, s), 7.03 (1H, s), 7.16 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.26 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.58 (1H, t, $J=8.0\text{Hz}$), 7.76 (1H, t, $J=8.0\text{Hz}$), 7.89 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.38 (1H, s), 9.15 (1H, s).
MS m/z : 340(M^+), 325, 311, 297, 284, 271, 258, 244, 142, 128.

【0205】

実施例 98

6'-メチル-1'-(4-メチルキノリン)-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-774 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.53-1.80 (10H, m), 2.35 (3H, s), 2.55 (3H, s), 2.88 (2H, s), 6.72 (1H, d, $J=7.9\text{Hz}$), 6.92 (1H, d, $J=7.9\text{Hz}$), 7.06 (1H, s), 7.58 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 7.71 (1H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 8.05 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.13 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 8.76 (1H, s).
MS m/z : 354(M^+), 353, 339, 311, 298, 168, 149, 115.

【0206】

実施例 99

6'-シアノ-1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘキサン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-786 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.47-1.84 (10H, m), 2.88 (2H, s), 7.37 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.55-7.78 (3H, m), 7.81 (1H, t, $J=8.0\text{Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.33 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.14 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).
MS m/z : 351(M^+), 322, 308, 295, 270, 255, 227.

【0207】

実施例 100

1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[シクロヘプタン-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-789 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55-1.87 (12H, m), 2.85 (2H, s), 7.20-7.26 (3H, m), 7.37-7.39 (1H, m), 7.58 (1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.75 (1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.87 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.15 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.36 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.14 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$).
MS m/z : 340(M^+), 283, 271, 230, 149, 128, 115.

【0208】

実施例 101

1'-キノリン-3-イル-4'-H-スピロ[(3-メチルシクロペンタン)-1, 3'-イソキノリン] (化合物番号 1-774 番)

物性: 油状物。

$^1\text{H-NMR}$ (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.06-2.89 (10H, s), 2.93 (2H, s), 7.19-7.307 (3H, m), 7.38-7.44 (1H, m), 7.58 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.76 (1H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$).

, J=8.3Hz), 8.17 (1H, d, J=8.3Hz), 8.37 (1H, s), 9.14 (1H, s).
MS m/z : 326(M⁺), 325, 311, 297, 283, 271, 230, 128, 115.

【0209】

実施例102

1-キノリン-3-イル-2', 3', 5', 6'-テトラヒドロ-4H-スピロ[イソキノリン-3, 4'-ピラン] (化合物番号1-791番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.72-1.76 (4H, m), 2.84 (2H, s), 3.76-3.83 (2H, m), 4.05-4.14 (2H, m), 7.19-7.30 (3H, m), 7.40-7.45 (1H, m), 7.58 (1H, t, J=8.2Hz), 7.76 (1H, t, J=8.2Hz), 7.87 (1H, d, J=8.2Hz), 8.15 (1H, d, J=8.2Hz), 8.38 (1H, s), 9.20 (1H, s).

MS m/z : 328(M⁺), 299, 283, 271, 255, 230, 128, 115.

【0210】

実施例103

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン 塩酸塩 (化合物番号1-793番)

物性: アモルファス。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.78 (6H, s), 3.31 (2H, brs), 7.26-7.47 (1H, m) 7.54 (2H, brs), 7.91 (1H, brs), 8.12 (1H, brs), 8.37 (1H, brs), 8.62 (1H, brs), 9.41 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

【0211】

実施例104

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン 硫酸塩 (化合物番号1-796番)

物性: アモルファス。

¹H-NMR (500MHz, D₂O) δ ppm : 1.51 (6H, s), 3.26 (2H, s), 7.25 (1H, d, J=7.6Hz) 7.42 (1H, td, J=5.5, 7.6Hz), 7.58 (1H, t, J=8.2Hz), 7.95 (1H, t, J=8.2Hz), 8.19 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 8.25 (1H, d, J=8.9Hz), 8.26 (1H, d, J=8.9Hz), 9.27 (1H, d, J=2.1Hz), 9.29 (1H, d, J=2.1Hz).

【0212】

実施例105

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン 硝酸塩 (化合物番号1-799番)

融点: 190~193℃。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.63 (6H, s), 3.18 (2H, s), 7.29 (1H, d, J=7.6Hz) 7.45-7.53 (2H, m), 7.75-7.78 (1H, m), 7.96-7.99 (1H, m), 8.10 (1H, d, J=8.2Hz), 8.26 (1H, d, J=8.9Hz), 9.06-9.07 (2H, m).

【0213】

実施例106

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン シュウ酸塩 (化合物番号1-802番)

物性: アモルファス。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.48 (6H, s), 3.03 (2H, s), 7.14 (1H, dd, J=3.4, 5.5Hz), 7.33-7.35 (2H, m), 7.70 (1H, t, J=8.2Hz), 7.89 (1H, t, J=8.2Hz), 7.96 (1H, t, J=8.2Hz), 8.28 (1H, d, J=8.2Hz), 8.68 (1H, s), 9.12 (1H, d, J=1.4Hz).

【0214】

実施例107

3-(5-フルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン メタンスルホン酸塩 (化合物番号1-804番)

融点: 227~230℃。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.77 (6H, s), 2.76 (6H, s), 3.31 (2H, s), 7.26-7.27 (1H, m), 7.51-7.59 (2H, m), 7.95 (1H, t, J=8.2Hz), 8.16 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 8.42 (1H, d, J=8.2Hz), 8.55 (1H, d, J=8.2Hz), 9.40 (1H, s), 9.91 (1H, s).

【0215】

実施例 108

3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン サリチル酸塩 (化合物番号 1-806 番)

物性: 油状物。

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.42 (6H, s), 2.93 (2H, s), 6.83-6.86 (1H, m), 6.94 (1H, d, J=8.2Hz), 7.05 (1H, d, J=6.9Hz), 7.22-7.29 (2H, m), 7.39-7.45 (1H, m), 7.64 (1H, dd, J=6.9, 8.2Hz), 7.83 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.9Hz), 7.88-7.90 (1H, m), 7.91 (1H, d, J=8.2Hz), 8.29 (1H, d, J=8.2Hz), 8.54 (1H, d, J=2.1Hz), 9.18 (1H, d, J=2.1Hz).

【0216】

実施例 109

3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン フマル酸塩 (化合物番号 1-807 番)

融点: 146~149°C。

¹H-NMR (500MHz, DMSO-d₆) δ ppm : 1.26 (6H, s), 2.84 (2H, s), 7.14 (1H, dd, J=1.4, 7.6Hz), 7.35-7.43 (2H, m), 7.68 (1H, t, J=8.2Hz), 7.84 (1H, ddd, J=1.4, 6.9, 8.2Hz), 8.09-8.12 (2H, m), 8.50 (1H, d, J=2.1Hz), 9.04 (1H, d, J=2.1Hz), 13.13 (2H, brs).

【0217】

実施例 110

3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 2-36 番)

融点: 142~144°C。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.27 (3H, s), 1.35 (3H, s), 2.74 (1H, d, J=16.5Hz), 2.86 (1H, d, J=16.5Hz), 5.35 (1H, s), 6.51 (1H, d, J=7.9Hz), 6.87-7.03 (2H, m), 7.54 (1H, t, J=7.9Hz), 7.70 (1H, t, J=7.9Hz), 7.79 (1H, d, J=7.9Hz), 8.09 (1H, d, J=2.1Hz), 8.10 (1H, d, J=7.9Hz), 8.84 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 306(M⁺), 291, 248, 220, 178, 162.

【0218】

実施例 111

3-(5-フルオロ-1,3,3-トリメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 2-37 番)

融点: 148~150°C。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.01 (3H, s), 1.39 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.84 (1H, d, J=16.3Hz), 2.86 (1H, d, J=16.3Hz), 4.59 (1H, s), 6.43 (1H, d, J=7.7Hz), 6.78-6.91 (2H, m), 7.53 (1H, t, J=8.2Hz), 7.68 (1H, t, J=8.2Hz), 7.80 (1H, d, J=8.2Hz), 8.06 (1H, d, J=1.8Hz), 8.08 (1H, d, J=8.2Hz), 8.81 (1H, d, J=1.8Hz).

MS m/z : 320(M⁺), 305, 248, 192, 176, 161.

【0219】

実施例 112

3-(5-クロロ-3,3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 2-40 番)

融点: 129~131°C。

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.26 (3H, s), 1.35 (3H, s), 2.78 (1H, d, J=16.5Hz), 2.92 (1H, d, J=16.5Hz), 5.34 (1H, s), 6.63 (1H, d, J=8.2Hz), 6.94 (1H, t, J=8.2Hz), 7.25 (1H, d, J=8.2Hz), 7.52 (1H, t, J=7.6Hz), 7.69 (1H, t, J=7.6Hz), 7.77

(1H, d, J=7.6Hz), 8.08 (1H, d, J=2.1Hz), 8.10 (1H, d, J=8.2Hz), 8.83 (1H, d, J=2.1Hz).

MS m/z : 322(M⁺), 307, 264, 230, 194, 178, 130, 115.

【0220】

実施例 113

3-(5-クロロ-1, 3, 3-トリメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 2-41 番)

融点: 142~144℃.

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.00 (3H, s), 1.40 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.95 (1H, d, J=15.8Hz), 2.97 (1H, d, J=15.8Hz), 4.60 (1H, s), 6.56 (1H, d, J=7.9Hz), 6.88 (1H, t, J=7.9Hz), 7.11 (1H, d, J=7.9Hz), 7.53 (1H, t, J=8.2Hz), 7.68 (1H, t, J=8.2Hz), 7.79 (1H, d, J=8.2Hz), 8.05 (1H, d, J=2.0Hz), 8.08 (1H, d, J=8.2Hz), 8.79 (1H, d, J=2.0Hz).

MS m/z : 336(M⁺), 323, 321, 264, 230, 208, 192, 142.

【0221】

実施例 114

3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン (化合物番号 1-866 番)

物性: アモルファス.

¹H-NMR (270MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.33 (6H, s), 1.46 (6H, d, J=3.4Hz), 6.96 (1H, dd, J=6.6, 2.1Hz), 7.15-7.20 (2H, m), 7.59 (1H, t, 7.5Hz), 7.76 (1H, dt, J=11.0, 3.8Hz), 7.87 (1H, d, J=7.9Hz), 8.16 (1H, d, J=8.5Hz), 8.31 (1H, d, J=2.1Hz), 9.03 (1H, d, J=1.8Hz).

MS m/z : 332(M⁺), 317, 289, 275, 260, 233, 146.

【0222】

製剤例 1

粉剤

実施例 1 の化合物 (1.0 質量部)、ドリレス A (アルキルエーテルリン酸エステル、日本化薬株式会社製、0.4 質量部)、カーブックス #80-D (ホワイトカーボン、塩野義製薬株式会社製、1.5 質量部)、炭酸カルシウム (足立石灰株式会社製、0.5 質量部) 及び啓和クレール風ヒ (啓和炉材株式会社製、32.1 質量部) を混合後、エックサンプル KII-1 型 (ハンマーミル)、不二パウダル株式会社製) で粉碎し、得られた粉碎物の質量に対して 1.5 倍量の DLクレール啓和 (啓和炉材株式会社製) を加え混合し、粉剤 DL を得た。

【0223】

製剤例 2

乳剤

実施例 2 の化合物 (10 質量部) をキシレン (和光純薬株式会社製、40 質量部) と DMSO (和光純薬株式会社製、35 質量部) の混合溶液に溶解し、この溶液に Parakol KPS (アニオン界面活性剤とノニオン界面活性剤の混合物、日本乳化剤株式会社製、25 質量部) を添加混合し、乳剤を得た。

【0224】

製剤例 3

水和剤

実施例 3 の化合物 (1 質量部)、カーブックス #80-D (10 質量部)、ゴーセノール GL05 (ポリビニルアルコール、日本合成化学株式会社製、2 質量部)、ニューコール 291PG (ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム塩、日本乳化剤株式会社製、0.5 質量部)、ネオゲンパウダー (直鎖アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩)、第一工業製薬株式会社製、5 質量部)、ラジオライト #200 (焼成珪藻土)、昭和化学工業株式会社製、10 質量部) 及び H 微分 (カオリナイトクレール、啓和炉材株式会社製、7

1. 5質量部)を十分に混合し、エックサンプルK I I-1型で粉碎し、水和剤を得た。

【0225】

製剤例4

粒剤

実施例4の化合物(2質量部)、トリポリリン酸ナトリウム(三井化学株式会社製、2質量部)、アミコールNO. 1(デキストリン、日本澱粉化学株式会社製、1.5質量部)、ベントナイト(豊順鉱業株式会社製、25質量部)及びカルヒン600(炭酸カルシウム、足立石灰株式会社製、69.5質量部)を混合し、ドームグラン(不二パウダル株式会社製、スクリーン0.9mmφ)を用いて押し出し造粒した。得られた造粒物を棚型乾燥機(タバイ株式会社製、PERFECT OVEN PS-222型、60℃)にて乾燥した後、600~1180μmに篩分して、粒剤を得た。

【0226】

試験例1

イネいもち病防除試験(治療効果)

第3~4葉期のポット栽培供試植物(イネ:幸風)に病原菌孢子懸濁液を噴霧接種し、室温が20~23℃の接種室に当該ポットを入れ発病を促した。本発明化合物をジメチルスルホキシド-メタノール混合溶液(容積比:7/3)に溶解せしめ、本発明化合物を300ppm含有する散布液を調整し、当該ポットに均一に散布した。接種7日後の発病程度を調査した。試験は2連で行った。

【0227】

なお、発病程度は、試験植物の発病程度を肉眼観察し、下記の基準で判定し、0~3の4段階で表した。

発病程度が0:発病が全く無い。

1:発病程度が無処理区の40%未満である。

2:発病程度が40%以上80%未満である。

3:発病程度が80%以上である。

【0228】

本試験の結果、実施例2(化合物番号1-32)、実施例4(化合物番号2-1)、実施例6(化合物番号1-1)、実施例7(化合物番号1-7)、実施例9(化合物番号1-19)、実施例14(化合物番号1-38)、実施例16(化合物番号1-41)、実施例18(化合物番号1-44)、実施例21(化合物番号1-54)、実施例22(化合物番号1-56)、実施例26(化合物番号1-69)、実施例30(化合物番号1-85)、実施例32(化合物番号1-94)、実施例33(化合物番号1-95)、実施例36(化合物番号1-100)、実施例38(化合物番号1-101)、実施例39(化合物番号101)、実施例51(化合物番号1-116)、実施例52(化合物番号1-117)、実施例55(化合物番号1-137)、実施例56(化合物番号1-147)、実施例57(化合物番号1-175)、実施例58(化合物番号1-185)、実施例59(化合物番号1-213)、実施例60(化合物番号1-251)、実施例62(化合物番号1-307)、実施例63(化合物番号1-345)、実施例66(化合物番号1-385)、実施例68(化合物番号1-387)、実施例69(化合物番号1-424)、実施例71(化合物番号1-464)、実施例72(化合物番号1-502)、実施例73(化合物番号1-540)、実施例74(化合物番号1-578)、実施例75(化合物番号1-594)、実施例79(化合物番号1-672)、実施例80(化合物番号1-710)、実施例81(化合物番号1-720)、実施例82(化合物番号1-721)、実施例101(化合物番号1-790)、実施例103(化合物番号1-793)、実施例104(化合物番号1-796)、実施例105(化合物番号1-799)、実施例106(化合物番号1-802)、実施例107(化合物番号1-804)、実施例108(化合物番号1-806)、実施例109(化合物番号1-807)、実施例110(化合物番号2-36)、実施例112(化合物番号2-40)及び実施例114(化合物番号1-866番)の化合物は、発病程度が0であった。

出証特2005-3015070

【0229】

試験例 2

トマト灰色かび病防除試験（予防効果）

第2～3葉期のポット栽培供試植物（トマト：大型福寿）に、原体をジメチルスルホキシドとメタノール（容積比7：3）に溶解せしめ、本発明化合物を300ppm含有する散布液を均一に散布した。1日栽培後、当該ポットに病原菌胞子懸濁液を噴霧接種し、室温が20～23度の接種室に当該ポットを入れ発病を促した。接種2日後の発病程度を調査した。試験は2連で行った。

【0230】

なお、発病程度は、試験植物の発病程度を肉眼観察し、下記の基準で判定し、0～3の4段階で表した。

発病程度が0：発病が全く無い。

1：発病程度が無処理区の40%未満である。

2：発病程度が40%以上80%未満である。

3：発病程度が80%以上である。

【0231】

本試験の結果、実施例2（化合物番号1-32）、実施例14（化合物番号1-38）、実施例18（化合物番号1-44）、実施例20（化合物番号1-53）、実施例21（化合物番号1-54）、実施例22（化合物番号1-56）、実施例23（化合物番号1-65）、実施例30（化合物番号1-85）、実施例44（化合物番号1-106）、実施例51（化合物番号1-116）、実施例52（化合物番号1-117）、実施例53（化合物番号1-126）、実施例56（化合物番号1-147）、実施例58（化合物番号1-185）、実施例66（化合物番号1-385）、実施例68（化合物番号1-387）、実施例69（化合物番号1-424）、実施例71（化合物番号1-464）、実施例72（化合物番号1-502）、実施例73（化合物番号1-540）、実施例75（化合物番号1-594）、実施例79（化合物番号1-672）、実施例92（化合物番号1-764）、実施例103（化合物番号1-793）、実施例107（化合物番号1-804）、実施例108（化合物番号1-806）、実施例109（化合物番号1-807）、実施例110（化合物番号2-36）、実施例112（化合物番号2-40）及び実施例番号114（化合物番号1-866番）の化合物は、発病程度が0であった。

【産業上の利用可能性】

【0232】

本発明化合物は、農園芸用殺菌剤として用いることができ、宿主植物に被害を与えることなく、種々の植物病原菌、特にイネいもち病に対して卓効を示すことから、農園芸用殺菌剤として優れたものである。

【0233】

本発明化合物が優れた効力を発揮する植物病害としては、例えばイネいもち病（*Piricularia oryzae*）並びにキュウリ、トマト及びインゲンの灰色かび病（*Botrytis cinerea*）が挙げられるが、本発明化合物の殺菌スペクトラムは、これらに限定されない。

【書類名】要約書

【要約】

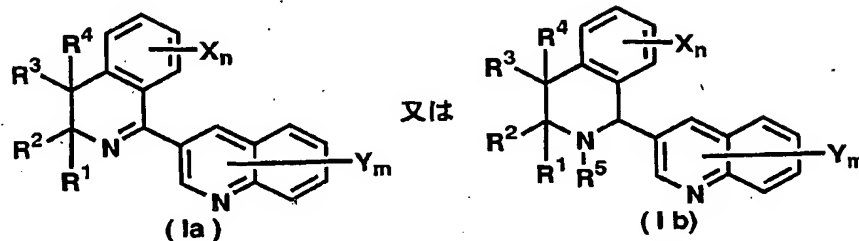
【課題】

種々の植物病害に対し優れた殺菌活性を有し、イネいもち病などに対して低薬量で防除が可能な農薬の有効成分として有用な化合物を提供する。

【解決手段】

下記一般式で表される化合物又はその塩。

【化 7】



ここで、 R^1 、 R^2 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基、又は、一緒になって $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル環を表し、 R^3 、 R^4 、 R^5 は、水素原子、又は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、 X は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、アリール基、ヘテロアリール基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、アミノ基、アシル基、シアノ基、又は、 N -ヒドロキシアルカンイミドイ基を表し、 Y は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、水酸基からなる群から選ばれる置換基を表し、 n は、 $0 \sim 4$ の整数を表し、 m は、 $0 \sim 6$ の整数を表す。

【書類名】 手続補正書
【整理番号】 KP-10891
【提出日】 平成16年 1月23日
【あて先】 特許庁長官殿
【事件の表示】
【出願番号】 特願2004- 15360
【補正をする者】
【識別番号】 303020956
【氏名又は名称】 三共アグロ株式会社
【代理人】
【識別番号】 100078662
【弁理士】
【氏名又は名称】 津国 肇
【電話番号】 03(3502)7212
【手続補正1】
【補正対象書類名】 特許願
【補正対象項目名】 発明者
【補正方法】 変更
【補正の内容】
【発明者】
【住所又は居所】 滋賀県野洲郡野洲町野洲 8 9 4 三共アグロ株式会社内
【氏名】 伊藤 寛之
【発明者】
【住所又は居所】 滋賀県野洲郡野洲町野洲 8 9 4 三共アグロ株式会社内
【氏名】 藤原 宏太
【発明者】
【住所又は居所】 滋賀県野洲郡野洲町野洲 8 9 4 三共アグロ株式会社内
【氏名】 森本 宗嗣
【発明者】
【住所又は居所】 滋賀県野洲郡野洲町野洲 8 9 4 三共アグロ株式会社内
【氏名】 田中 治一
【発明者】
【住所又は居所】 滋賀県野洲郡野洲町野洲 8 9 4 三共アグロ株式会社内
【氏名】 玉川 靖
【その他】 願書の発明者の住所又は居所の欄において「滋賀県野洲郡野洲町野洲 8 9 4 三共アグロ株式会社内」を「滋賀県野州郡野州町野州 8 9 4 三共アグロ株式会社内」と誤記していたことが判明しました。これは代理人が「洲」を「州」と錯誤して入力したためであり、本補正により正しく訂正する次第です。

特願 2004-015360

出願人履歴情報

識別番号

[303020956]

1. 変更年月日

2003年 4月10日

[変更理由]

新規登録

住 所

東京都文京区本郷4-23-14

氏 名

三共アグロ株式会社